

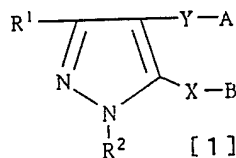


## 特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(51) 国際特許分類 5 C07D 401/06, 401/12, 401/14 C07D 403/06, 403/12, 403/14 C07D 417/06, 417/12, 417/14 A01N 43/54, 43/56, 43/58 A01N 43/60, 43/707, 43/78		A1	(11) 国際公開番号 <b>WO 92/08715</b>
(21) 国際出願番号 PCT/JP91/01538 (22) 国際出願日 1991年11月8日(08. 11. 91)		(43) 国際公開日 1992年5月29日(29. 05. 1992)	
(30) 優先権データ 特願平2/305340 1990年11月9日(09. 11. 90) JP 特願平3/94264 1991年4月24日(24. 04. 91) JP 特願平3/266474 1991年10月15日(15. 10. 91) JP		(74) 代理人 伊藤 忠(ITO, Tadashi) 〒349-02 埼玉県南埼玉郡白岡町大字白岡1470 日産化学工業株式会社 生物科学研究所内 Saitama, (JP) 弁理士 粁 経夫, 外(HANABUSA, Tuneo et al.) 〒101 東京都千代田区神田駿河台1丁目6番地 お茶の水スクエアB館, 粁特許事務所 Tokyo, (JP)	
(71) 出願人 日産化学工業株式会社 (NISSAN CHEMICAL INDUSTRIES, LTD.)[JP/JP] 〒101 東京都千代田区神田錦町3丁目7番地1 Tokyo, (JP)		(81) 指定国 AT(欧州特許), BE(欧州特許), CH(欧州特許), DE(欧州特許), DK(欧州特許), ES(欧州特許), FR(欧州特許), GB(欧州特許), GR(欧州特許), IT(欧州特許), LU(欧州特許), NL(欧州特許), SE(欧州特許).	
(72) 発明者 中島康之(NAKAJIMA, Yasuyuki) 渡辺淳一(WATANABE, Junichi) 廣原洋司(HIROHARA, Yohji) 三田猛志(MITA, Takeshi) 鈴木秀雄(SUZUKI, Hideo) 〒274 千葉県船橋市坪井町722番地1 日産化学工業株式会社 中央研究所内 Chiba, (JP) 花上雅美(HANAUE, Masami) 大宅博司(OHYA, Hiroshi) 豊田竜太郎(TOYODA, Ryutaro) 中山雅人(NAKAYAMA, Masato)		添付公開書類 国際調査報告書	

(54) Title : SUBSTITUTED PYRAZOLE DERIVATIVE AND AGROHORTICULTURAL BACTERICIDE

(54) 発明の名称 置換ピラゾール誘導体および農園芸用殺菌剤

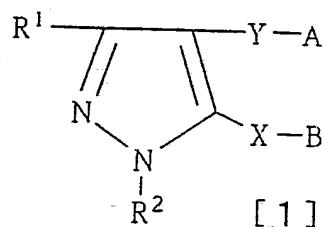


## (57) Abstract

A novel substituted pyrazole derivative represented by general formula (1) and an agrohorticultural bactericide containing the same, wherein R<sup>1</sup> represents hydrogen, halogen, alkyl, alkoxy, alkylthio or haloalkyl; R<sup>2</sup> represents hydrogen, alkyl, haloalkyl, optionally substituted phenylalkyl, -COR<sup>6</sup> or -SO<sub>2</sub>R<sup>7</sup>; X represents -S(O)<sub>0-2</sub>-, -NR<sup>3</sup>-, -CO- or -CR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>-, Y represents -O- or -S(O)<sub>0-2</sub>-, A represents optionally substituted phenyl or heterocyclic group; and B represents optionally substituted pyridyl, diazinyl, 1, 3, 6- or 1, 3, 4- triazinyl or thiazolyl. The above compound is useful as an agrohorticultural bactericide, because it has an excellent agrohorticultural bactericidal action and is free from chemical injury against useful crops.

## (57) 要約

一般式〔1〕で表される新規の置換ピラゾール誘導体およびこれらを含む農園芸用殺菌剤。これらの化合物は、優れた農園芸用殺菌作用を示し、有用作物に対する



薬害も認められないため、農園芸用殺菌剤として有用である。〔式〔1〕中、 $R^1$ は、水素原子、ハロゲン原子、アルキル基、アルコキシ基、アルキルチオ基またはハロアルキル基を表し； $R^2$ は、水素原子、アルキル基、ハロアルキル基、任意に置換したフェニルアルキル基、 $-\text{COR}^6$  または  $-\text{SO}_2\text{R}^7$  を表し； $X$  は、 $-\text{S}(\text{O})_{0-2}-$ 、 $-\text{N}(\text{R}^3)-$ 、 $-\text{CO}-$  または  $-\text{C}(\text{R}^4)(\text{R}^5)-$  を表し； $Y$  は、酸素原子または  $-\text{S}(\text{O})_{0-2}-$  を表し； $A$  は、任意に置換したフェニル基または複素環基を表し； $B$  は任意に置換したピリジル、ジアジニル、1,3,6-または1,3,4-トリアジニルまたはチアゾリル基を表す。〕

## 情報としての用途のみ

PCTに基づいて公開される国際出願のパンフレット第1頁にPCT加盟国を同定するために使用されるコード

AT オーストリア  
AU オーストラリア  
BB バルバードス  
BE ベルギー  
BF ブルキナ・ファソ  
BG ブルガリア  
BJ ベナン  
BR ブラジル  
CA カナダ  
CF 中央アフリカ共和国  
CG コンゴ  
CH スイス  
CI コート・ジボアール  
CM カメルーン  
CS ナエコスロバキア  
DE ドイツ  
DK デンマーク

ES スペイン  
FI フィンランド  
FR フランス  
GA ガボン  
GI ギニア  
GB イギリス  
GR ギリシャ  
HU ハンガリー  
IT イタリア  
JP 日本  
KP 朝鮮民主主義人民共和国  
KR 大韓民国  
LI リヒテンシュタイン  
LK スリランカ  
LU ルクセンブルグ  
MC モナコ  
MG マダガスカル

ML マリ  
MN モンゴル  
MR モロニア  
MW マラウイ  
NL オランダ  
NO ノルウェー  
PL ポーランド  
RO ルーマニア  
SD スーダン  
SE スウェーデン  
SN セネガル  
SU<sup>+</sup> ソヴィエト連邦  
TD チャド  
TG トーゴ  
US 米国

<sup>+</sup>SUの指定はロシア連邦の指定としての効力を有する。しかし、その指定が旧ソヴィエト連邦のロシア連邦以外の他の国で効力を有するかは不明である。

## 明 細 書

## 発 明 の 名 称

置換ピラゾール誘導体および農園芸用殺菌剤

## 技 術 分 野

本発明は、新規なピラゾール誘導体および該誘導体を有効成分として含有する農園芸用殺菌剤に関する。

## 背 景 技 術

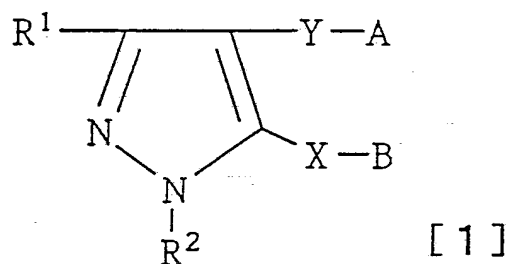
これまで種々の殺菌剤が開発されてきているが、その効力や耐性菌の出現等で必ずしも満足すべきものとは言えない。

また特開平 1-125379 号公報には、ある種のピラゾール誘導体が殺菌活性を有することが記載されている。

上記の公開公報に記載されている化合物においても、効力、残効性、薬害等の点で満足すべきものではなく、植物病害に対して更に有用な農園芸用殺菌剤の開発が要望されている。

## 発 明 の 開 示

本発明者らは、このような状況に鑑み、優れた殺菌活性を有する化合物を開発すべく種々検討を重ねた結果、下記一般式〔1〕で示される置換ピラゾール誘導体が、優れた殺菌活性を有することを見出し本発明に至った。すなわち、本発明は、一般式〔1〕



〔上記式中、 $R^1$ は、水素原子、ハロゲン原子、アルキル基、アルコキシ基、アルキルチオ基またはハロアルキル基を表し、

$R^2$ は、水素原子、アルキル基、ハロアルキル基、無置換もしくは置換基を有するフェニルアルキル基、 $-COR^6$ または $-SO_2R^7$ を表し、

$X$ は、 $-S-$ 、 $-SO-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-N(R^8)-$ 、 $-CO-$ または $-C(R^4)(R^5)-$ を表し、

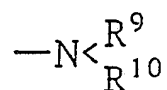
$R^8$ は、水素原子、アルキル基、ハロアルキル基、アルケニル基、アルキニル基、アルコキシアルキル基、シアノアルキル基、アルキルカルボニルアルキル基、アルコキシカルボニルアルキル基、ニトロソ基、アミノ基、無置換もしくは置換基を有するフェニルアルキル基、 $-COR^6$ または $-SO_2R^7$ を表し、

$R^4$ および $R^5$ は、それぞれ独立に水素原子、ハロゲン原子、アルキル基、ハロアルキル基、アルケニル基、アルキニル基または $-OR^8$ を表し、

$R^8$ は、水素原子、アルキル基、ハロアルキル基、アルケニル基、アルキニル基、アルコキシアルキル基、シアノアルキル基、アルキルカルボニルアルキル基、アルコ

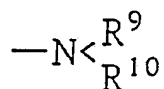
キシカルボニルアルキル基、無置換もしくは置換基を有するフェニルアルキル基、 $-\text{COR}^6$  または  $-\text{SO}_2\text{R}^7$  を表し、

$\text{R}^6$  は、水素原子、アルキル基、ハロアルキル基、無置換もしくは置換基を有するフェニル基、無置換もしくは置換基を有するフェニルアルキル基、アルコキシ基または



を表し、

$\text{R}^7$  は、アルキル基、ハロアルキル基、無置換もしくは置換基を有するフェニル基または



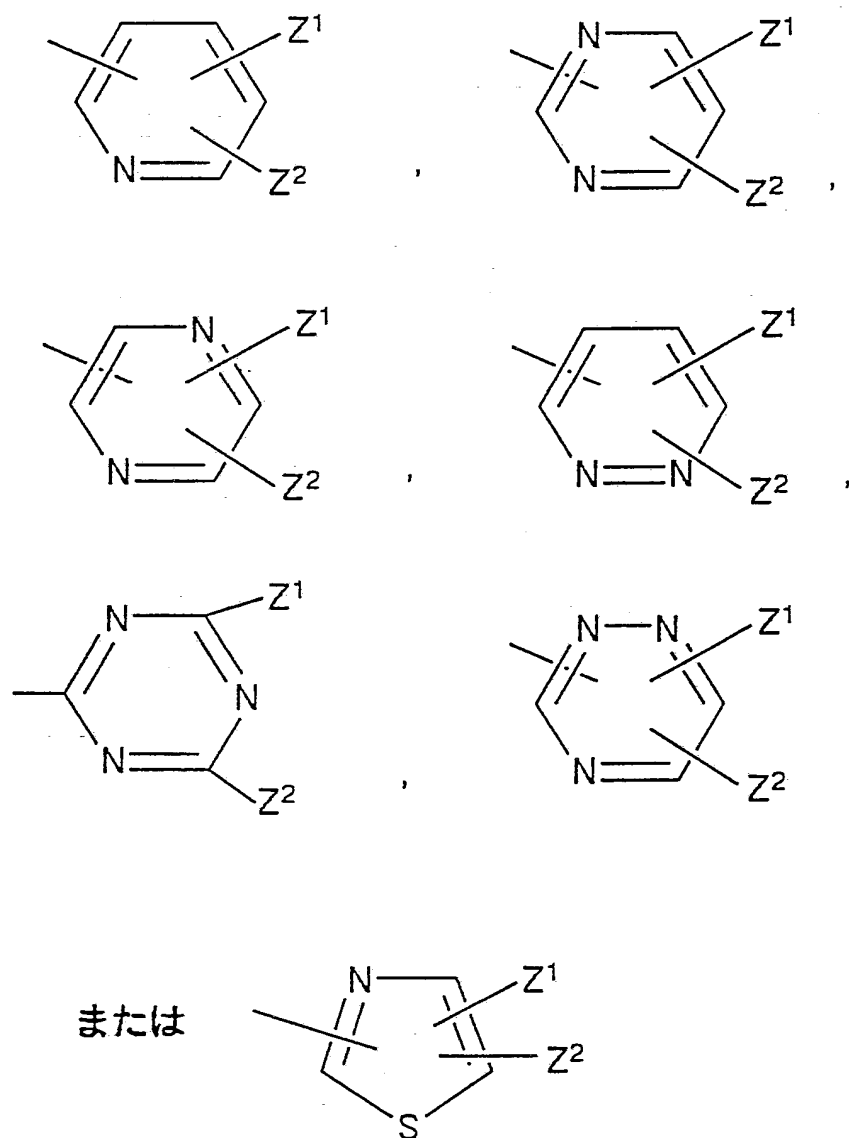
を表し、

$\text{R}^9$  および  $\text{R}^{10}$  は、それぞれ独立に水素原子、アルキル基または無置換もしくは置換基を有するフェニル基を表し、

$\text{Y}$  は、酸素原子、 $-\text{S}-$ 、 $-\text{SO}-$ 、または  $-\text{SO}_2-$  を表し、

$\text{A}$  は、無置換もしくは置換基を有するフェニル基または無置換もしくは置換基を有する複素環基を表し、

$\text{B}$  は、



を表し、

$Z^1$ および $Z^2$ は、それぞれ独立に水素原子、ハロゲン原子、アルキル基、アルコキシ基、ハロアルキル基を表す。]

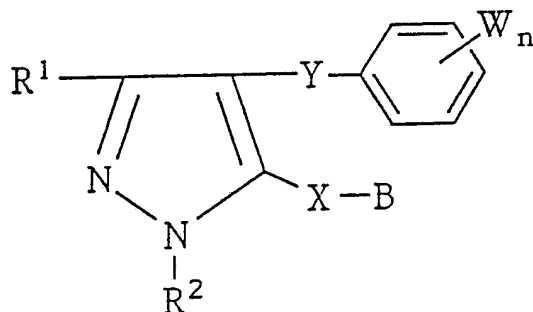
で表される置換ピラゾール誘導体および該誘導体を有効

成分として含有する農園芸用殺菌剤に関するものである。

次に、一般式〔1〕で表される本発明化合物を第1表～第2表に示す。但し、本発明化合物はこれらのみに限定されるものではない。

化合物No. は、後の記載において参照される。なお各表中の Ph はフェニル基を、i はイソを、t はターシャリを示す。

第 1 表



で表される化合物において

第 1 表 ( 続 き )

化合物 No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	W <sup>a</sup>	B
1	H	CH <sub>3</sub>	S	S	H	B 1
2	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	S	S	H	B 1
3	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	S	S	H	B 1
4	H	CH <sub>3</sub>	S	S	4-Cl	B 1
5	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	S	S	4-Cl	B 1
6	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	S	S	4-Cl	B 1
7	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	S	S	4-CH <sub>3</sub>	B 1
8	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	S	S	4-CH <sub>3</sub>	B 1
9	CH <sub>3</sub>	H	S	S	4-Cl	B 1
10	CH <sub>3</sub>	H	S	S	4-CH <sub>3</sub>	B 1
11	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	S	S	4-Cl	B 1



第 1 表 (続き)

化合物 No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	W <sub>n</sub>	B
1 2	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	S	S	4-CH <sub>3</sub>	B 1
1 3	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	S	S	4-CF <sub>3</sub>	B 1
1 4	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	S	S	4-Br	B 1
1 5	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	S	S	4-NO <sub>2</sub>	B 1
1 6	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	S	S	4-OCH <sub>3</sub>	B 1
1 7	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	S	S	4-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	B 1
1 8	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	S	S	2-Cl	B 1
1 9	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	S	S	2-Cl, 4-Cl	B 1
2 0	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	S	S	2-Cl, 4-CH <sub>3</sub>	B 1
2 1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	S	S	4-Cl	B 2
2 2	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	S	S	4-Cl	B 2

第 1 表 (続き)

化合物 No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	W <sup>n</sup>	B
2 3	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	S	S	4-CH <sub>3</sub>	B 2
2 4	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	S	S	4-CH <sub>3</sub>	B 2
2 5	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	S	S	2-Cl, 4-Cl	B 2
2 6	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	S	S	2-Cl, 4-CH <sub>3</sub>	B 2
2 7	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	S	0	4-Cl	B 2
2 8	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	S	0	4-CH <sub>3</sub>	B 2
2 9	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	S	0	4-CH <sub>3</sub>	B 2
3 0	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	S	0	3-Cl, 4-CH <sub>3</sub>	B 2
3 1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	S	S	H	B 1
3 2	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	S	S	4-Cl	B 1

第 1 表 (続き)

化合物 No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	W <sub>n</sub>	B
3 3	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	S	S	4-CH <sub>3</sub>	B 1
3 4	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	S	S	4-OCH <sub>3</sub>	B 1
3 5	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	S	S	3-CF <sub>3</sub>	B 1
3 6	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	S	S	2-Cl, 4-Cl	B 1
3 7	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	S	S	3-Cl, 4-Cl	B 1
3 8	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	S	S	2-Cl, 4-CH <sub>3</sub>	B 1
3 9	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>	S	S	4-Cl	B 1
4 0	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>	S	S	4-CH <sub>3</sub>	B 1
4 1	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>	S	S	4-OCH <sub>3</sub>	B 1
4 2	t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	S	S	4-Cl	B 1

第 1 表 (続き)

化合物 No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	W <sup>n</sup>	B
4 3	t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	S	S	4-CH <sub>3</sub>	B 1
4 4	t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	S	S	4-OCH <sub>3</sub>	B 1
4 5	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	S	S	4-Cl	B 1
4 6	CH <sub>3</sub>	C <sub>8</sub> H <sub>7</sub>	S	S	4-Cl	B 1
4 7	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	H	B 1
4 8	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	H	B 1
4 9	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	4-Cl	B 1
5 0	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	4-Cl	B 1
5 1	H	CH <sub>3</sub>	NH	S	4-Cl	B 1
5 2	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	4-CH <sub>3</sub>	B 1

第 1 表 ( 続 き )

化合物 No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	W <sub>n</sub>	B
5 3	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	4-CH <sub>3</sub>	B 1
5 4	H	CH <sub>3</sub>	NH	S	4-CH <sub>3</sub>	B 1
5 5	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	4-F	B 1
5 6	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	4-Br	B 1
5 7	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	4-I	B 1
5 8	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-F	B 1
5 9	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-Cl	B 1
6 0	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-Br	B 1
6 1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-I	B 1
6 2	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	3-F	B 1

第 1 表 ( 続き )

化合物 No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	W <sub>n</sub>	B
6 3	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	3-Cl	B 1
6 4	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	3-Br	B 1
6 5	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	3-I	B 1
6 6	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-OCH <sub>3</sub>	B 1
6 7	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	3-OCH <sub>3</sub>	B 1
6 8	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	4-OCH <sub>3</sub>	B 1
6 9	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-CF <sub>3</sub>	B 1
7 0	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	3-CF <sub>3</sub>	B 1
7 1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	4-CF <sub>3</sub>	B 1
7 2	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	4-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	B 1

第 1 表 ( 続 き )

化合物 No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	W <sub>n</sub>	B
7 3	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	4-C <sub>8</sub> H <sub>7</sub>	B 1
7 4	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	4-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	B 1
7 5	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	4-i-C <sub>8</sub> H <sub>7</sub>	B 1
7 6	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	4-t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	B 1
7 7	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-OCF <sub>3</sub>	B 1
7 8	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	3-OCF <sub>3</sub>	B 1
7 9	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	4-OCF <sub>3</sub>	B 1
8 0	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	3-NO <sub>2</sub>	B 1
8 1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	4-NO <sub>2</sub>	B 1
8 2	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	3-NH <sub>2</sub>	B 1

第 1 表 (続 き)

化合物 No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	W <sup>n</sup>	B
8 3	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	4-NH <sub>2</sub>	B 1
8 4	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	4-NHCOCH <sub>3</sub>	B 1
8 5	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	4-NHSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	B 1
8 6	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	4-NHCOCF <sub>3</sub>	B 1
8 7	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	4-NHSO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	B 1
8 8	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	4-Ph	B 1
8 9	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	4-OPh	B 1
9 0	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	4-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	B 1
9 1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	4-COCH <sub>3</sub>	B 1
9 2	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	4-NHCOPh	B 1



第 1 表 (続 き)

化合物 No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	W <sup>n</sup>	B
9 3	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	4-NHC00CH <sub>3</sub>	B 1
9 4	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	4-NHC0N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	B 1
9 5	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-Cl, 3-Cl	B 1
9 6	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-Cl, 4-Cl	B 1
9 7	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-Cl, 5-Cl	B 1
9 8	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-Cl, 6-Cl	B 1
9 9	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	3-Cl, 4-Cl	B 1
1 0 0	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	3-Cl, 5-Cl	B 1
1 0 1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-CH <sub>3</sub> , 3-CH <sub>3</sub>	B 1
1 0 2	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-CH <sub>3</sub> , 4-CH <sub>3</sub>	B 1

第 1 表 (続き)

化合物 No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	W <sub>n</sub>	B
1 0 3	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-CH <sub>3</sub> , 5-CH <sub>3</sub>	B 1
1 0 4	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-CH <sub>3</sub> , 6-CH <sub>3</sub>	B 1
1 0 5	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	3-CH <sub>3</sub> , 4-CH <sub>3</sub>	B 1
1 0 6	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	3-CH <sub>3</sub> , 5-CH <sub>3</sub>	B 1
1 0 7	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-Cl, 3-CH <sub>3</sub>	B 1
1 0 8	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-Cl, 4-CH <sub>3</sub>	B 1
1 0 9	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-Cl, 5-CH <sub>3</sub>	B 1
1 1 0	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	3-Cl, 4-CH <sub>3</sub>	B 1
1 1 1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	3-Cl, 5-CH <sub>3</sub>	B 1
1 1 2	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-CH <sub>3</sub> , 3-Cl	B 1

第 1 表 (続き)

化合物 No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	W <sub>n</sub>	B
1 1 3	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-CH <sub>3</sub> , 4-Cl	B 1
1 1 4	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-CH <sub>3</sub> , 5-Cl	B 1
1 1 5	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-F, 3-F	B 1
1 1 6	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-F, 4-F	B 1
1 1 7	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-F, 5-F	B 1
1 1 8	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-F, 6-F	B 1
1 1 9	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-F, 3-Cl	B 1
1 2 0	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-F, 4-Cl	B 1
1 2 1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-F, 5-Cl	B 1
1 2 2	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-F, 6-Cl	B 1

第 1 表 (続き)

化合物 No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	W <sub>n</sub>	B
1 2 3	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-F, 3-CH <sub>3</sub>	B 1
1 2 4	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-F, 4-CH <sub>3</sub>	B 1
1 2 5	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-F, 3-Br	B 1
1 2 6	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-F, 4-Br	B 1
1 2 7	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	3-F, 4-Cl	B 1
1 2 8	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	3-F, 5-Cl	B 1
1 2 9	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	3-F, 4-CH <sub>3</sub>	B 1
1 3 0	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	3-F, 5-CH <sub>3</sub>	B 1
1 3 1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-Br, 4-Cl	B 1
1 3 2	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-Br, 4-Br	B 1

第 1 表 (続き)

化合物 No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	W <sub>n</sub>	B
1 3 3	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-Br, 4-CH <sub>3</sub>	B 1
1 3 4	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	3-Br, 4-Cl	B 1
1 3 5	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	3-Br, 4-Br	B 1
1 3 6	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	3-Br, 4-CH <sub>3</sub>	B 1
1 3 7	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-Cl, 4-Br	B 1
1 3 8	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	3-Cl, 4-Br	B 1
1 3 9	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-Cl, 4-I	B 1
1 4 0	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	3-Cl, 4-I	B 1
1 4 1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	3-F, 4-Br	B 1
1 4 2	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	3, 4-OCH <sub>2</sub> O-	B 1

第 1 表 ( 続 き )

化合物 No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	W <sub>n</sub>	B
1 4 3	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-CF <sub>3</sub> , 3-Cl	B 1
1 4 4	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-CF <sub>3</sub> , 4-Cl	B 1
1 4 5	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-CF <sub>3</sub> , 3-Br	B 1
1 4 6	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-CF <sub>3</sub> , 4-Br	B 1
1 4 7	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-F, 4-NO <sub>2</sub>	B 1
1 4 8	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	3-F, 4-NO <sub>2</sub>	B 1
1 4 9	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-Cl, 4-NO <sub>2</sub>	B 1
1 5 0	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	3-Cl, 4-NO <sub>2</sub>	B 1
1 5 1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-F, 4-CH <sub>3</sub>	B 1
1 5 2	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	3-F, 4-CH <sub>3</sub>	B 1

第 1 表 (続き)

化合物 No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	W <sup>n</sup>	B
1 5 3	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-Cl, 4-OCH <sub>3</sub>	B 1
1 5 4	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	3-Cl, 4-OCH <sub>3</sub>	B 1
1 5 5	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-OCH <sub>3</sub> , 4-OCH <sub>3</sub>	B 1
1 5 6	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	3-OCH <sub>3</sub> , 4-OCH <sub>3</sub>	B 1
1 5 7	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-Cl, 3-Cl, 4-Cl	B 1
1 5 8	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-Cl, 4-Cl, 5-Cl	B 1
1 5 9	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-Cl, 4-Cl, 6-Cl	B 1
1 6 0	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	3-Cl, 4-Cl, 5-Cl	B 1
1 6 1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-Cl, 3-Cl, 4-CH <sub>3</sub>	B 1
1 6 2	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-Cl, 3-Cl, 4-Br	B 1

第 1 表 ( 続き )

化合物 No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	W <sub>n</sub>	B
1 6 3	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-Cl, 3-Cl, 4-I	B 1
1 6 4	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-Cl, 4-Br, 6-Cl	B 1
1 6 5	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-Cl, 4-CH <sub>3</sub> , 6-Cl	B 1
1 6 6	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-Br, 4-Cl, 6-Cl	B 1
1 6 7	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NCHO	S	4-Cl	B 1
1 6 8	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NC(=O)CH <sub>3</sub>	S	4-Cl	B 1
1 6 9	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NC(=O)OCH <sub>3</sub>	S	4-Cl	B 1
1 7 0	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NC(=O)N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	S	4-Cl	B 1
1 7 1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NC(=O)NHPh	S	4-Cl	B 1
1 7 2	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	S	4-Cl	B 1



第 1 表 ( 続 き )

化合物 No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	W <sup>n</sup>	B
1 7 3	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	S	4-Cl	B 1
1 7 4	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	S	4-Cl	B 1
1 7 5	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	S	4-Cl	B 1
1 7 6	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	S	4-Cl	B 1
1 7 7	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	S	4-Cl	B 1
1 7 8	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NCH <sub>2</sub> C≡CH	S	4-Cl	B 1
1 7 9	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NCH <sub>2</sub> COCH <sub>3</sub>	S	4-Cl	B 1
1 8 0	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NCH <sub>2</sub> COOCH <sub>3</sub>	S	4-Cl	B 1
1 8 1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NCH <sub>2</sub> COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	S	4-Cl	B 1
1 8 2	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NCH <sub>2</sub> CN	S	4-Cl	B 1

第 1 表 (続き)

化合物 No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	W <sub>n</sub>	B
1 8 3	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NCH <sub>2</sub> Ph	S	4-Cl	B 1
1 8 4	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -4-Cl	S	4-Cl	B 1
1 8 5	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -4-CH <sub>3</sub>	S	4-Cl	B 1
1 8 6	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Ph	S	4-Cl	B 1
1 8 7	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	S	4-Cl	B 1
1 8 8	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NSO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	S	4-Cl	B 1
1 8 9	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NCHO	S	4-Cl	B 2
1 9 0	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	S	4-Cl	B 2
1 9 1	CH <sub>3</sub>	H	NH	S	4-Cl	B 1
1 9 2	CH <sub>3</sub>	H	NH	S	2-Cl, 4-Cl	B 1

第 1 表 ( 続き )

化合物 No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	W <sup>a</sup>	B
1 9 3	CH <sub>3</sub>	H	NH	S	3-Cl, 4-CH <sub>3</sub>	B 1
1 9 4	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	NH	S	4-Cl	B 1
1 9 5	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	NH	S	4-Br	B 1
1 9 6	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	NH	S	2-Cl, 4-Cl	B 1
1 9 7	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	NH	S	2-Cl, 4-CH <sub>3</sub>	B 1
1 9 8	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	NH	S	4-Cl	B 1
1 9 9	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	NH	S	4-Br	B 1
2 0 0	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	NH	S	2-Cl, 4-Cl	B 1
2 0 1	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	NH	S	2-Cl, 4-CH <sub>3</sub>	B 1
2 0 2	CH <sub>3</sub>	t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	NH	S	4-Cl	B 1

第 1 表 (続き)

化合物 No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	W <sup>n</sup>	B
2 0 3	CH <sub>3</sub>	t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	NH	S	2-Cl, 4-Cl	B 1
2 0 4	CH <sub>3</sub>	t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	NH	S	3-Cl, 4-CH <sub>3</sub>	B 1
2 0 5	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	NH	S	4-Cl	B 1
2 0 6	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	NH	S	4-Br	B 1
2 0 7	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	NH	S	2-Cl, 4-Cl	B 1
2 0 8	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	NH	S	3-Cl, 4-CH <sub>3</sub>	B 1
2 0 9	CH <sub>3</sub>	H	NH	S	4-Cl	B 2
2 1 0	CH <sub>3</sub>	H	NH	S	2-Cl, 4-Cl	B 2
2 1 1	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	NH	S	4-Cl	B 2
2 1 2	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>8</sub> H <sub>7</sub>	NH	S	4-Cl	B 2

第 1 表 (続き)

化合物 No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	W <sup>a</sup>	B
2 1 3	CH <sub>3</sub>	t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	NH	S	4-Cl	B 2
2 1 4	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	NH	S	2-Cl, 4-Cl	B 2
2 1 5	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> Ph	NH	S	4-Cl	B 1
2 1 6	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> Ph	NH	S	2-Cl, 4-Cl	B 1
2 1 7	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> Ph	NCHO	S	2-Cl, 4-Cl	B 1
2 1 8	CH <sub>3</sub>	CHO	NH	S	4-Cl	B 1
2 1 9	CH <sub>3</sub>	CHO	NCHO	S	4-Cl	B 1
2 2 0	CH <sub>3</sub>	CHO	NH	S	2-Cl, 4-Cl	B 1
2 2 1	CH <sub>3</sub>	CHO	NCHO	S	2-Cl, 4-Cl	B 1
2 2 2	CH <sub>3</sub>	COCH <sub>3</sub>	NH	S	4-Cl	B 1

第 1 表 (続 き)

化合物 No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	W <sup>n</sup>	B
2 2 3	CH <sub>3</sub>	COCH <sub>3</sub>	NH	S	4-Br	B 1
2 2 4	CH <sub>3</sub>	COCH <sub>3</sub>	NH	S	2-Cl, 4-Cl	B 1
2 2 5	CH <sub>3</sub>	COCH <sub>3</sub>	NCHO	S	2-Cl, 4-Cl	B 1
2 2 6	CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	NH	S	4-Cl	B 1
2 2 7	CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	NH	S	2-Cl, 4-Cl	B 1
2 2 8	CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	NH	S	3-Cl, 4-CH <sub>3</sub>	B 1
2 2 9	CH <sub>3</sub>	CONHCH <sub>3</sub>	NH	S	4-Cl	B 1
2 3 0	CH <sub>3</sub>	CONHCH <sub>3</sub>	NH	S	4-Br	B 1
2 3 1	CH <sub>3</sub>	CONHCH <sub>3</sub>	NH	S	2-Cl, 4-Cl	B 1
2 3 2	CH <sub>3</sub>	CONHCH <sub>3</sub>	NH	S	3-Cl, 4-CH <sub>3</sub>	B 1

第 1 表 ( 続き )

化合物 No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	W <sub>n</sub>	B
2 3 3	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> Ph	NH	S	4-Cl	B 2
2 3 4	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> Ph	NH	S	2-Cl, 4-Cl	B 2
2 3 5	CH <sub>3</sub>	COCH <sub>3</sub>	NH	S	4-Cl	B 2
2 3 6	CH <sub>3</sub>	CONHCH <sub>3</sub>	NH	S	4-Cl	B 2
2 3 7	CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	NH	S	4-Cl	B 2
2 3 8	CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	NH	S	2-Cl, 4-Cl	B 2
2 3 9	H	CH <sub>3</sub>	NH	S	4-Cl	B 1
2 4 0	H	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-Cl, 4-Cl	B 1
2 4 1	H	CH <sub>3</sub>	NH	S	3-Cl, 4-CH <sub>3</sub>	B 1
2 4 2	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	4-Cl	B 1

第 1 表 (続き)

化合物 No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	W <sup>n</sup>	B
2 4 3	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	4-Br	B 1
2 4 4	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-Cl, 4-Cl	B 1
2 4 5	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-Cl, 4-CH <sub>3</sub>	B 1
2 4 6	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	4-Cl	B 1
2 4 7	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	4-Br	B 1
2 4 8	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-Cl, 4-Cl	B 1
2 4 9	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-Cl, 4-CH <sub>3</sub>	B 1
2 5 0	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	4-Cl	B 1
2 5 1	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-Cl, 4-Cl	B 1
2 5 2	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	3-Cl, 4-CH <sub>3</sub>	B 1



第 1 表 ( 続 き )

化合物 No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	W <sub>n</sub>	B
2 5 3	t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	4-Cl	B 1
2 5 4	t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	4-Br	B 1
2 5 5	t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-Cl, 4-Cl	B 1
2 5 6	t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	3-Cl, 4-CH <sub>3</sub>	B 1
2 5 7	H	CH <sub>3</sub>	NH	S	4-Cl	B 2
2 5 8	H	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-Cl, 4-Cl	B 2
2 5 9	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	4-Cl	B 2
2 6 0	i-C <sub>8</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	4-Cl	B 2
2 6 1	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	4-Cl	B 2
2 6 2	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-Cl, 4-Cl	B 2

第 1 表 (続き)

化合物 No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	W <sup>n</sup>	B
2 6 3	Cl	CH <sub>3</sub>	NH	S	4-Cl	B 1
2 6 4	Cl	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-Cl, 4-Cl	B 1
2 6 5	Cl	CH <sub>3</sub>	NH	S	3-Cl, 4-CH <sub>3</sub>	B 1
2 6 6	Cl	CH <sub>3</sub>	NCHO	S	4-Cl	B 1
2 6 7	Cl	CH <sub>3</sub>	NH	S	4-Br	B 1
2 6 8	Cl	CH <sub>3</sub>	NCHO	S	2-Cl, 4-Cl	B 1
2 6 9	Cl	CH <sub>3</sub>	NCHO	S	2-Cl, 4-CH <sub>3</sub>	B 1
2 7 0	CH <sub>3</sub> O	CH <sub>3</sub>	NH	S	4-Cl	B 1
2 7 1	CH <sub>3</sub> O	CH <sub>3</sub>	NH	S	4-Br	B 1
2 7 2	CH <sub>3</sub> O	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-Cl, 4-Cl	B 1

第 1 表 ( 続き )

化合物 No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	W <sub>n</sub>	B
2 7 3	CH <sub>3</sub> O	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-Cl, 4-CH <sub>3</sub>	B 1
2 7 4	CH <sub>3</sub> O	CH <sub>3</sub>	NCHO	S	4-Cl	B 1
2 7 5	CH <sub>3</sub> O	CH <sub>3</sub>	NCHO	S	2-Cl, 4-Cl	B 1
2 7 6	CH <sub>3</sub> O	CH <sub>3</sub>	NCHO	S	3-Cl, 4-CH <sub>3</sub>	B 1
2 7 7	CH <sub>3</sub> S	CH <sub>3</sub>	NH	S	4-Cl	B 1
2 7 8	CH <sub>3</sub> S	CH <sub>3</sub>	NH	S	4-Br	B 1
2 7 9	CH <sub>3</sub> S	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-Cl, 4-Cl	B 1
2 8 0	CH <sub>3</sub> S	CH <sub>3</sub>	NH	S	3-Cl, 4-CH <sub>3</sub>	B 1
2 8 1	CH <sub>3</sub> S	CH <sub>3</sub>	NCHO	S	4-Cl	B 1
2 8 2	CH <sub>3</sub> S	CH <sub>3</sub>	NCHO	S	2-Cl, 4-Cl	B 1

第 1 表 ( 続 き )

化合物 No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	W <sub>n</sub>	B
2 8 3	Cl	CH <sub>3</sub>	NH	S	4-Cl	B 2
2 8 4	Cl	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-Cl, 4-Cl	B 2
2 8 5	CH <sub>3</sub> O	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-Cl, 4-Cl	B 2
2 8 6	CH <sub>3</sub> S	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-Cl, 4-Cl	B 2
2 8 7	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	SO	S	4-Cl	B 1
2 8 8	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub>	S	4-Cl	B 1
2 8 9	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	SO	4-Cl	B 1
2 9 0	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	SO <sub>2</sub>	4-Cl	B 1
2 9 1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	SO	2-Cl, 4-Cl	B 1
2 9 2	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	SO <sub>2</sub>	2-Cl, 4-Cl	B 1

第 1 表 (続き)

化合物 No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	W <sub>n</sub>	B
2 9 3	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	SO	3-Cl, 4-CH <sub>3</sub>	B 1
2 9 4	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	SO <sub>2</sub>	3-Cl, 4-CH <sub>3</sub>	B 1
2 9 5	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	S	0	4-Cl	B 1
2 9 6	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	SO	0	4-Cl	B 1
2 9 7	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub>	0	4-Cl	B 1
2 9 8	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	S	0	2-Cl, 4-Cl	B 1
2 9 9	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	SO	0	2-Cl, 4-Cl	B 1
3 0 0	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub>	0	2-Cl, 4-Cl	B 1
3 0 1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	0	4-Cl	B 1
3 0 2	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	0	4-CH <sub>3</sub>	B 1

第 1 表 (続き)

化合物 No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	W <sup>n</sup>	B
3 0 3	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	0	2-Cl, 4-Cl	B 1
3 0 4	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	0	2-Cl, 4-CH <sub>3</sub>	B 1
3 0 5	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	0	3-Cl, 4-CH <sub>3</sub>	B 1
3 0 6	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	0	2-F, 4-Cl	B 1
3 0 7	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NCHO	0	4-Cl	B 1
3 0 8	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	0	4-Cl	B 1
3 0 9	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	0	4-Cl	B 2
3 1 0	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	0	2-Cl, 4-Cl	B 2
3 1 1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	4-F	B 2
3 1 2	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	4-Cl	B 2

第 1 表 (続き)

化合物 No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	W <sup>n</sup>	B
3 1 3	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	4-CH <sub>3</sub>	B 2
3 1 4	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-Cl, 4-Cl	B 2
3 1 5	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	3-Cl, 4-Cl	B 2
3 1 6	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-Cl, 4-CH <sub>3</sub>	B 2
3 1 7	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	3-Cl, 4-CH <sub>3</sub>	B 2
3 1 8	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-F, 4-F	B 2
3 1 9	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-F, 4-Cl	B 2
3 2 0	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-F, 4-Br	B 2
3 2 1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-F, 4-CH <sub>3</sub>	B 2
3 2 2	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	3-F, 4-CH <sub>3</sub>	B 2

第 1 表 (続き)

化合物 No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	W <sup>n</sup>	B
3 2 3	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NCHO	S	4-Cl	B 2
3 2 4	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NCHO	S	2-Cl, 4-Cl	B 2
3 2 5	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NCHO	S	3-Cl, 4-CH <sub>3</sub>	B 2
3 2 6	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	4-Cl	B 3
3 2 7	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	4-Br	B 3
3 2 8	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-Cl, 4-Cl	B 3
3 2 9	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-Cl, 4-CH <sub>3</sub>	B 3
3 3 0	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	3-Cl, 4-CH <sub>3</sub>	B 3
3 3 1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	4-Cl	B 4
3 3 2	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-Cl, 4-Cl	B 4



第 1 表 (続き)

化合物 No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	W <sup>n</sup>	B
3 3 3	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	4-Cl	B 5
3 3 4	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-Cl, 4-Cl	B 5
3 3 5	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	4-Cl	B 6
3 3 6	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-Cl, 4-Cl	B 6
3 3 7	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	4-Cl	B 7
3 3 8	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-Cl, 4-CH <sub>3</sub>	B 7
3 3 9	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	4-Cl	B 8
3 4 0	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-Cl, 4-Cl	B 8
3 4 1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	4-Cl	B 9
3 4 2	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-Cl, 4-CH <sub>3</sub>	B 9

第 1 表 (続き)

化合物 No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	W <sup>n</sup>	B
3 4 3	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	4-Cl	B 1 0
3 4 4	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-Cl, 4-Cl	B 1 0
3 4 5	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	3-Cl, 4-Cl	B 1 0
3 4 6	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-F, 4-CH <sub>3</sub>	B 1 0
3 4 7	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	3-F, 4-CH <sub>3</sub>	B 1 0
3 4 8	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-F, 4-Cl	B 1 0
3 4 9	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	4-Cl	B 1 1
3 5 0	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-Cl, 4-CH <sub>3</sub>	B 1 1
3 5 1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	4-Cl	B 1 2
3 5 2	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-Cl, 4-Cl	B 1 2

第 1 表 ( 続き )

化合物 No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	W <sub>n</sub>	B
3 5 3	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-F, 4-CH <sub>3</sub>	B 1 2
3 5 4	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	3-F, 4-CH <sub>3</sub>	B 1 2
3 5 5	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-Cl, 4-CH <sub>3</sub>	B 1 2
3 5 6	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	3-Cl, 4-CH <sub>3</sub>	B 1 2
3 5 7	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NCHO	S	4-Cl	B 1 2
3 5 8	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NCHO	S	2-Cl, 4-Cl	B 1 2
3 5 9	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	4-Cl	B 1 3
3 6 0	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-Cl, 4-Cl	B 1 3
3 6 1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-Cl, 4-CH <sub>3</sub>	B 1 3

第 1 表 (続き)

化合物 No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	W <sub>n</sub>	B
3 6 2	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-F, 4-CH <sub>3</sub>	B 1 3
3 6 3	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	4-Cl	B 1 4
3 6 4	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-Cl, 4-Cl	B 1 4
3 6 5	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-Cl, 4-CH <sub>3</sub>	B 1 4
3 6 6	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-F, 4-CH <sub>3</sub>	B 1 4
3 6 7	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	4-Cl	B 1 5
3 6 8	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-Cl, 4-Cl	B 1 5
3 6 9	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-Cl, 4-CH <sub>3</sub>	B 1 5
3 7 0	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-F, 4-CH <sub>3</sub>	B 1 5
3 7 1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	4-Cl	B 1 6

第 1 表 (続き)

化合物 No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	W <sub>n</sub>	B
3 7 2	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-Cl, 4-Cl	B 1 6
3 7 3	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-Cl, 4-CH <sub>3</sub>	B 1 6
3 7 4	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-F, 4-CH <sub>3</sub>	B 1 6
3 7 5	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	4-Cl	B 1 7
3 7 6	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-Cl, 4-Cl	B 1 7
3 7 7	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-Cl, 4-CH <sub>3</sub>	B 1 7
3 7 8	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-F, 4-CH <sub>3</sub>	B 1 7
3 7 9	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	4-Cl	B 1 8
3 8 0	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-Cl, 4-Cl	B 1 8
3 8 1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-Cl, 4-CH <sub>3</sub>	B 1 8

第 1 表 (続き)

化合物 No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	W <sub>n</sub>	B
3 8 2	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	2-F, 4-CH <sub>3</sub>	B 1 8
3 8 3	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NCHO	S	2-Cl, 4-Cl	B 1
3 8 4	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NCHO	S	3-Cl, 4-Cl	B 1
3 8 5	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NCHO	S	2-F, 4-Cl	B 1
3 8 6	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NCHO	S	2-F, 4-CH <sub>3</sub>	B 1
3 8 7	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NCHO	S	3-F, 4-Cl	B 1
3 8 8	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NCHO	S	3-F, 4-CH <sub>3</sub>	B 1
3 8 9	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NCHO	S	2-Cl, 4-CH <sub>3</sub>	B 1
3 9 0	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NCHO	S	3-Cl, 4-CH <sub>3</sub>	B 1
3 9 1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NCHO	S	2-Cl, 3-Cl, 4-Cl	B 1

第 1 表 ( 続 き )

化合物 No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	W <sub>n</sub>	B
3 9 2	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NCHO	S	2-Cl, 4-Cl, 5-Cl	B 1
3 9 3	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NC(=O)CH <sub>3</sub>	S	2-Cl, 4-Cl	B 1
3 9 4	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NC(=O)CH <sub>3</sub>	S	3-Cl, 4-Cl	B 1
3 9 5	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NC(=O)CH <sub>3</sub>	S	2-F, 4-CH <sub>3</sub>	B 1
3 9 6	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NC(=O)CH <sub>3</sub>	S	2-Cl, 3-Cl, 4-Cl	B 1
3 9 7	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	S	2-Cl, 4-Cl	B 1
3 9 8	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	S	3-Cl, 4-CH <sub>3</sub>	B 1
3 9 9	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NNO	S	2-Cl, 4-Cl	B 1
4 0 0	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NNO	S	3-Cl, 4-CH <sub>3</sub>	B 1
4 0 1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NNH <sub>2</sub>	S	4-Cl	B 1

第 1 表 (続き)

化合物 No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	W <sup>n</sup>	B
4 0 2	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NNH <sub>2</sub>	S	2-Cl, 4-Cl	B 1
4 0 3	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NNH <sub>2</sub>	S	3-Cl, 4-CH <sub>3</sub>	B 1
4 0 4	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	S	2-Cl, 4-Cl	B 1
4 0 5	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	S	2-F, 4-CH <sub>3</sub>	B 1
4 0 6	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	S	2-Cl, 3-Cl, 4-Cl	B 1
4 0 7	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	S	4-Cl	B 1
4 0 8	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	S	2-Cl, 4-Cl	B 1
4 0 9	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	S	2-Cl, 4-CH <sub>3</sub>	B 1
4 1 0	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	S	2-F, 4-CH <sub>3</sub>	B 1
4 1 1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH(OH)	S	4-Cl	B 1



第 1 表 (続き)

化合物 No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	W <sub>n</sub>	B
4 1 2	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH(OH)	S	2-Cl, 4-Cl	B 1
4 1 3	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH(OH)	S	2-Cl, 4-CH <sub>3</sub>	B 1
4 1 4	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH(OH)	S	3-Cl, 4-CH <sub>3</sub>	B 1
4 1 5	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH(OH)	S	2-F, 4-CH <sub>3</sub>	B 1
4 1 6	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH(OH)	S	3-F, 4-CH <sub>3</sub>	B 1
4 1 7	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH(OCCH <sub>3</sub> )	S	4-Cl	B 1
4 1 8	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH(OCCH <sub>3</sub> )	S	2-Cl, 4-Cl	B 1
4 1 9	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH(OCOCH <sub>3</sub> )	S	4-Cl	B 1
4 2 0	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH(OCOCH <sub>3</sub> )	S	2-Cl, 4-Cl	B 1
4 2 1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH(OCOCH <sub>3</sub> )	S	2-Cl, 4-CH <sub>3</sub>	B 1

第 1 表 ( 続き )

化合物 No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	W <sub>n</sub>	B
4 2 2	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH(OCOCH <sub>3</sub> )	S	2-F, 4-CH <sub>3</sub>	B 1
4 2 3	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH(F)	S	4-Cl	B 1
4 2 4	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH(F)	S	2-Cl, 4-Cl	B 1
4 2 5	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH(Cl)	S	4-Cl	B 1
4 2 6	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH(Cl)	S	2-Cl, 4-Cl	B 1
4 2 7	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C=O	S	4-Cl	B 1
4 2 8	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C=O	S	2-Cl, 4-Cl	B 1
4 2 9	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C=O	S	2-Cl, 4-CH <sub>3</sub>	B 1
4 3 0	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C=O	S	2-F, 4-CH <sub>3</sub>	B 1
4 3 1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	S	4-Cl	B 2

第 1 表 (続 き)

化合物 No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	W <sub>n</sub>	B
4 3 2	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	S	2-Cl, 4-Cl	B 2
4 3 3	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	S	2-Cl, 4-CH <sub>3</sub>	B 2
4 3 4	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	S	2-F, 4-CH <sub>3</sub>	B 2
4 3 5	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH(OH)	S	4-Cl	B 2
4 3 6	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH(OH)	S	2-Cl, 4-Cl	B 2
4 3 7	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH(OH)	S	2-Cl, 4-CH <sub>3</sub>	B 2
4 3 8	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH(OH)	S	3-Cl, 4-CH <sub>3</sub>	B 2
4 3 9	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH(OH)	S	2-F, 4-CH <sub>3</sub>	B 2
4 4 0	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH(OH)	S	3-F, 4-CH <sub>3</sub>	B 2
4 4 1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH(OCH <sub>3</sub> )	S	4-Cl	B 2

第 1 表 (続き)

化合物 No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	W <sub>n</sub>	B
4 4 2	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH(OCCH <sub>3</sub> )	S	2-Cl, 4-Cl	B 2
4 4 3	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH(OCOCCH <sub>3</sub> )	S	4-Cl	B 2
4 4 4	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH(OCOCCH <sub>3</sub> )	S	2-Cl, 4-Cl	B 2
4 4 5	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH(OCOCCH <sub>3</sub> )	S	2-Cl, 4-CH <sub>3</sub>	B 2
4 4 6	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH(OCOCCH <sub>3</sub> )	S	2-F, 4-CH <sub>3</sub>	B 2
4 4 7	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH(F)	S	4-Cl	B 2
4 4 8	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH(F)	S	2-Cl, 4-Cl	B 2
4 4 9	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH(Cl)	S	4-Cl	B 2
4 5 0	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH(Cl)	S	2-Cl, 4-Cl	B 2
4 5 1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C=O	S	4-Cl	B 2

第 1 表 (続き)

化合物 No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	W <sub>n</sub>	B
4 5 2	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C=O	S	2-Cl, 4-Cl	B 2
4 5 3	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C=O	S	2-Cl, 4-CH <sub>3</sub>	B 2
4 5 4	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C=O	S	2-F, 4-CH <sub>3</sub>	B 2
4 5 5	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C(CH <sub>3</sub> )(OH)	S	4-Cl	B 2
4 5 6	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C(CH <sub>3</sub> )(OH)	S	2-Cl, 4-Cl	B 2
4 5 7	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C(CH <sub>3</sub> )(OCOCH <sub>3</sub> )	S	4-Cl	B 2
4 5 8	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C(CH <sub>3</sub> )(OCOCH <sub>3</sub> )	S	2-Cl, 4-Cl	B 2
4 5 9	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C(CH <sub>3</sub> )(F)	S	4-Cl	B 2
4 6 0	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C(CH <sub>3</sub> )(F)	S	2-Cl, 4-Cl	B 2
4 6 1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )(OH)	S	4-Cl	B 2

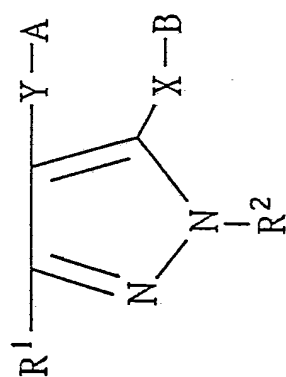
第 1 表 (続き)

化合物 No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	W <sub>n</sub>	B
4 6 2	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )(OH)		S 2-Cl, 4-Cl	B 2
4 6 3	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C(i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> )(OH)		S 4-Cl	B 2
4 6 4	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C(i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> )(OH)		S 2-Cl, 4-Cl	B 2
4 6 5	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C(i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> )(OH)		S 2-Cl, 4-CH <sub>3</sub>	B 2
4 6 6	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C(i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> )(OH)		S 2-F, 4-CH <sub>3</sub>	B 2
4 6 7	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> )		S 4-Cl	B 2
4 6 8	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> )		S 2-Cl, 4-Cl	B 2
4 6 9	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> )		S 2-Cl, 4-CH <sub>3</sub>	B 2
4 7 0	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> )		S 2-F, 4-CH <sub>3</sub>	B 2
4 7 1	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		S 4-Cl	B 2

第 1 表 (続き)

化合物 No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	W <sup>n</sup>	B
4 7 2	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	S	2-Cl, 4-Cl	B 2
4 7 3	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	S	2-Cl, 4-CH <sub>3</sub>	B 2
4 7 4	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	S	2-F, 4-CH <sub>3</sub>	B 2
4 7 5	CH <sub>3</sub> O	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	S	4-Cl	B 2
4 7 6	CH <sub>3</sub> O	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	S	2-Cl, 4-Cl	B 2
4 7 7	CH <sub>3</sub> O	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	S	2-Cl, 4-CH <sub>3</sub>	B 2
4 7 8	CH <sub>3</sub> O	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	S	2-F, 4-CH <sub>3</sub>	B 2

第 2 表



で表される化合物において

化合物 No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	A	B
4 7 9	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	A 1	B 1
4 8 0	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	A 1	B 2
4 8 1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	A 2	B 1



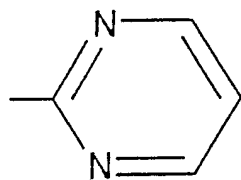
第 2 表 ( 続 き )

化合物 No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	W <sub>n</sub>	B
4 8 2	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	A 2	B 2
4 8 3	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	A 3	B 1
4 8 4	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	A 3	B 2
4 8 5	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	A 4	B 1
4 8 6	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	A 4	B 2
4 8 7	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	A 5	B 1
4 8 8	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	A 5	B 2
4 8 9	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	A 6	B 1
4 9 0	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	A 6	B 2
4 9 1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	A 7	B 1

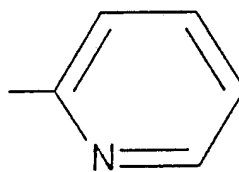
第 2 表 (続き)

化合物 No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	W <sup>n</sup>	B
4 9 2	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	A 7	B 2
4 9 3	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	A 8	B 1
4 9 4	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	A 8	B 2
4 9 5	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	A 9	B 1
4 9 6	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	A 9	B 2
4 9 7	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	A 1 0	B 1
4 9 8	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	A 1 0	B 2
4 9 9	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	A 1 1	B 1
5 0 0	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	S	A 1 1	B 2

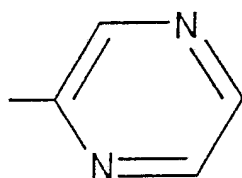
上記表中において、B 1 - B 1 8 は以下の化学構造を表す。



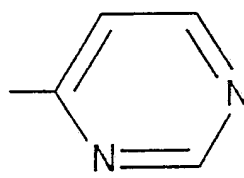
B1



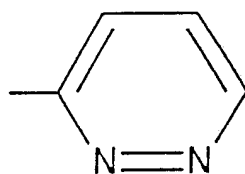
B2



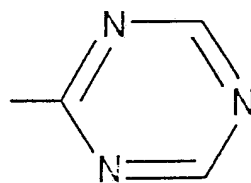
B3



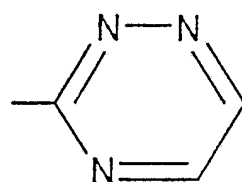
B4



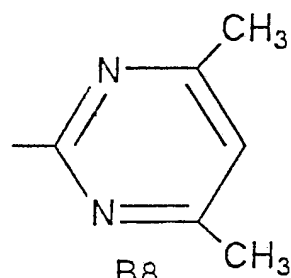
B5



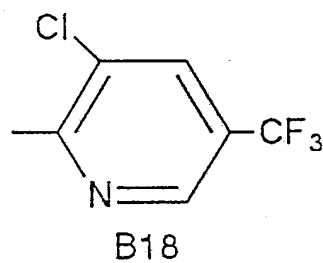
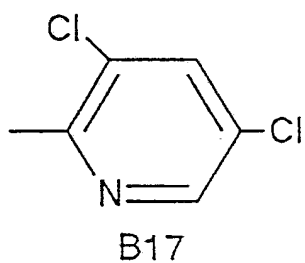
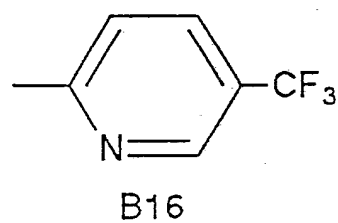
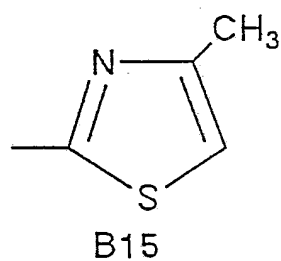
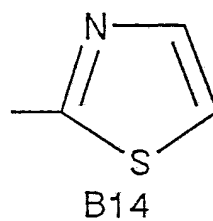
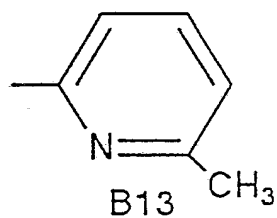
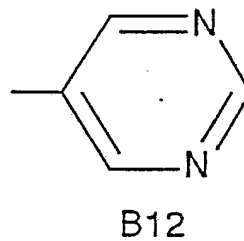
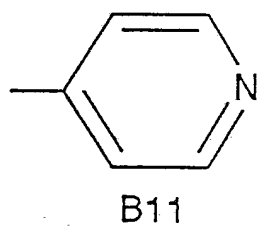
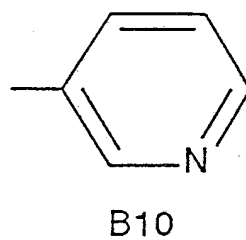
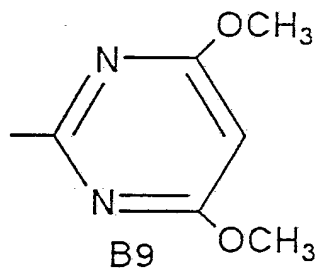
B6



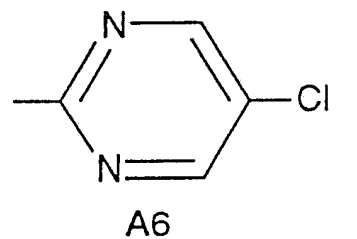
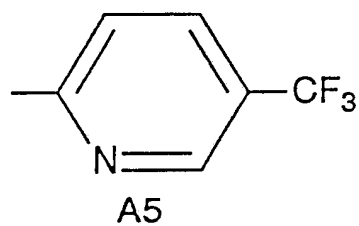
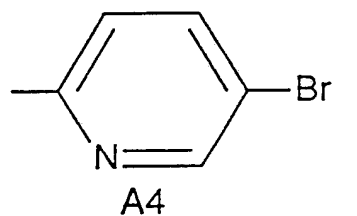
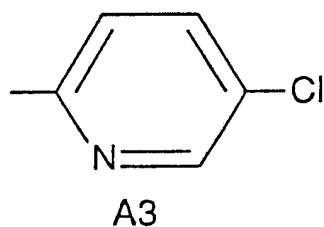
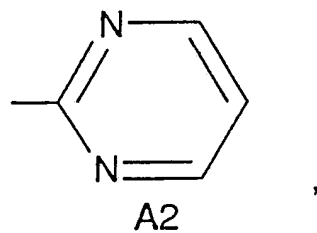
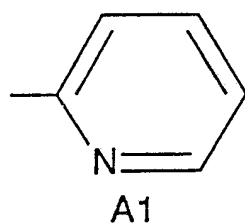
B7

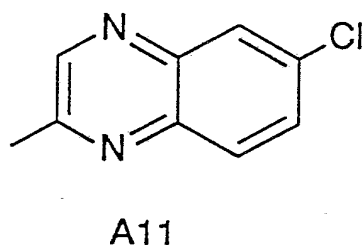
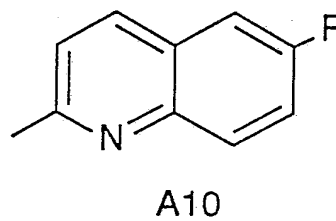
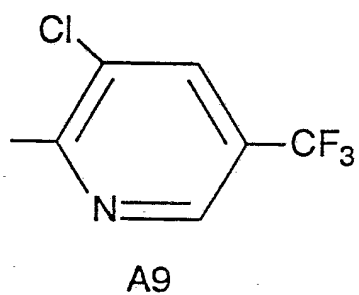
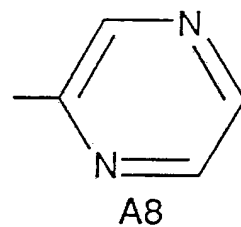
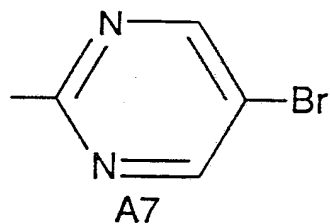


B8



上記表中において、A 1 - A 1 1 は以下の化学構造を表す。

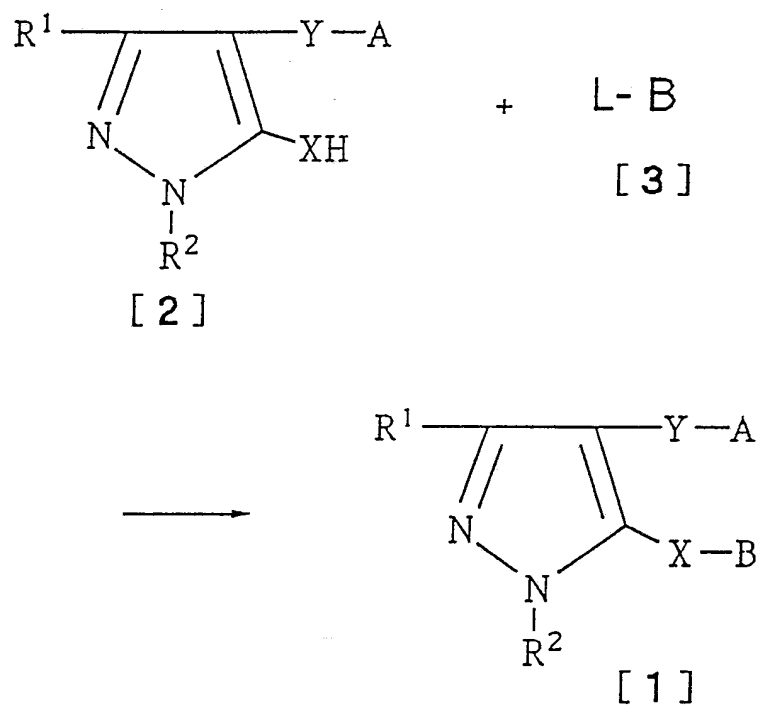




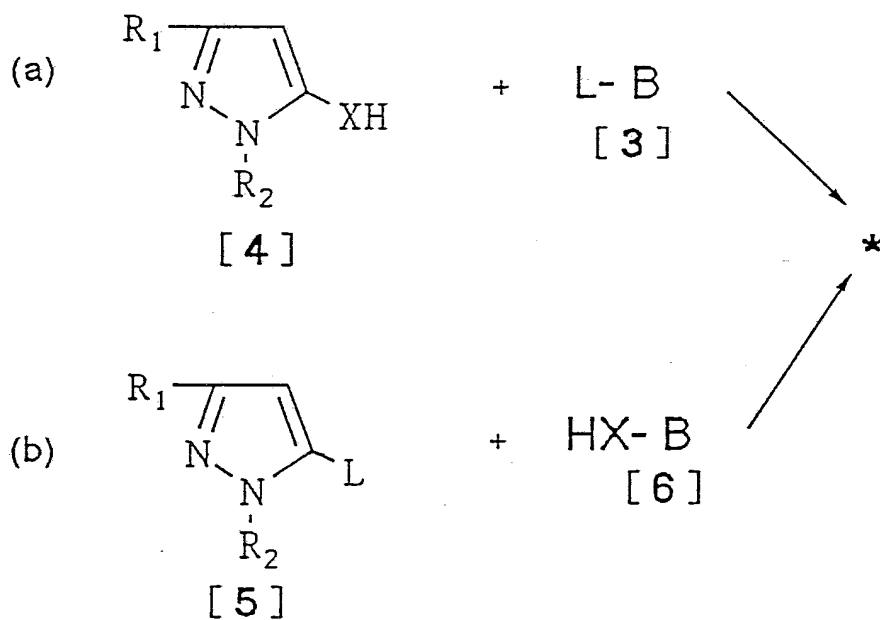
次に本発明化合物の製造法を反応スキームで示し、以下に説明する。

反応スキーム

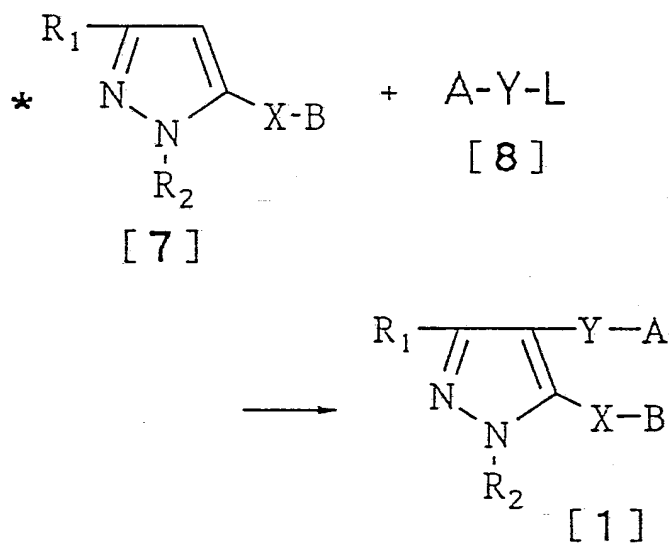
(製法1)



(製法 2)

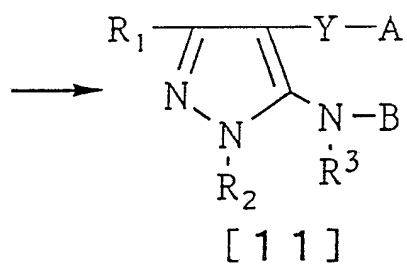
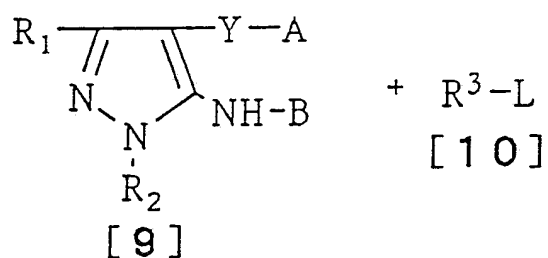


Y ≠ O の時



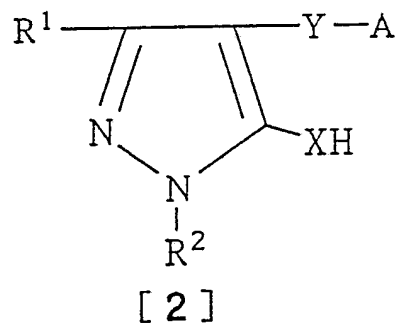


(製法 3)

 $X=N-R^3$ ,  $R^3 \neq H$  の時

(製法 1)

一般式 [2]



[式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $X$ 、 $Y$ および $A$ は前記と同じ意味を表す。]

で示される置換ピラゾールと

## 一般式 [ 3 ]



〔式中、Lはハロゲン原子等の脱離基を表し、Bは前記と同じ意味を表す。〕

で示される複素環とを反応させることによって本発明化合物を製造することができる。この際にXが $-NCOR^4$ または $-NSO_2R^5$ である時は、後処理等において加水分解をうけ、Xが $-NH$ で得られる場合もある。

上記反応に於いて、溶媒は必ずしも必要ではないが、用いられる溶媒としては、例えば、トルエン、キシレン、クロルベンゼン等の炭化水素類、ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、ジイソプロピルエーテル、ジオキサン等のエーテル類、酢酸エチル等のエステル類、アセトニトリル等のニトリル類、ジメチルスルホキシド、ジメチルホルムアミド等の極性溶媒が挙げられる。

また必要に応じて有機塩基（ピリジン、トリエチルアミンなど）や無機塩基（炭酸カリウム、水素化ナトリウムなど）を加えてもよい。

また必要に応じて、銅塩や銅錯体を触媒として加えてもよい。

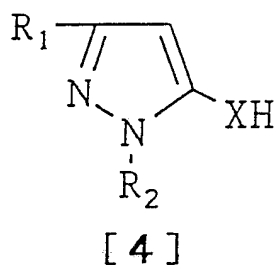
上記反応に用いられる試剤の量は、一般式 [ 2 ] で示される置換ピラゾール 1 当量に対して、一般式 [ 3 ] で示される複素環は 1 ～ 5 当量の範囲である。

上記反応に於いて反応温度は任意にとりうるが通常、室温～200℃もしくは溶媒の還流温度が好ましい。

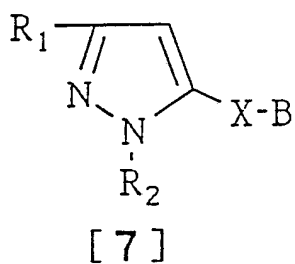
反応終了後は通常の後処理を行なうことにより目的物を得ることができる。

(製法 2)

(a) 一般式 [ 4 ]



〔式中  $R^1$ ,  $R^2$  および  $X$  は前記と同じ意味を表す。〕で示されるピラゾールと一般式 [ 3 ] で示される複素環とを必要に応じて適当な溶媒と塩基を用いて反応させることによって一般式 [ 7 ]



〔式中  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $X$  および  $B$  は前記と同じ意味を表す。〕を製造する。この際に  $X$  が  $-NCOR^4$  または  $-NSO_2R^5$  である時は、後処理等において加水分解を受け、 $X$  が  $-NH$  で得られる場合もある。

上記反応に於いて、用いられる溶媒としては、例えば、

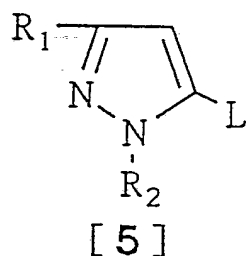
トルエン、キシレン、クロルベンゼン等の炭化水素類、ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、ジイソプロピルエーテル、ジオキサン等のエーテル類、酢酸エチル等のエステル類、アセトニトリル等のニトリル類、ジメチルスルホキシド、ジメチルホルムアミド等の極性溶媒が挙げられる。

また用いられる塩基としては、例えば炭酸カリウム、水素化ナトリウムなどが挙げられる。

また必要に応じて、銅塩や銅錯体等を触媒として加えてもよい。

上記反応において反応温度は、任意にとりうるが通常、室温～200℃もしくは溶媒の還流温度が好ましい。

(b) 一般式 [ 5 ]

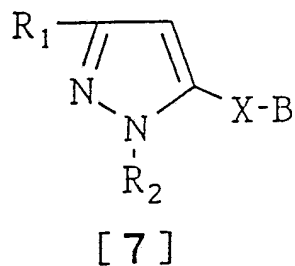


〔式中  $R^1$ ,  $R^2$  は前記と同じ意味を表し、 $L$  はハロゲン原子等の脱離基を表す。〕 示されるピラゾールと一般式 [ 6 ]



〔式中  $X$  および  $B$  は前記と同じ意味を表す。〕 示される複素環とを必要に応じて適当な溶媒と塩基を

用いて反応させることによって一般式〔7〕



〔式中 $R^1$ ,  $R^2$ ,  $X$ および $B$ は前記と同じ意味を表す。〕  
を製造する。この際に $X$ が $-NCOR^4$ または $-NSO_2R^5$ である時は、後処理等において加水分解を受け、 $X$ が $-NH$ で得られる場合もある。

上記反応に於いて、用いられる溶媒としては、例えば、トルエン、キシレン、クロルベンゼン等の炭化水素類、ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、ジイソプロピルエーテル、ジオキサン等のエーテル類、酢酸エチル等にエステル類、アセトニトリル等のニトリル類、ジメチルスルホキシド、ジメチルホルムアミド等の極性溶媒が挙げられる。

また用いられる塩基としては、炭酸カリウム、水素化ナトリウムなどが挙げられる。

また必要に応じて、銅塩や銅錯体等を触媒として加えてもよい。

上記反応において反応温度は任意にとりうるが通常、室温～200℃もしくは溶媒の還流温度が好ましい。

次の上記(a)または(b)で得られた一般式〔7〕で示されるピラゾールと一般式〔8〕



[ 8 ]

〔式中 A は前記と同じ意味を表し、Y は酸素原子を除く前記と同じ意味を表し、L はハロゲン原子等の脱離基を表す〕

で示される化合物とを必要に応じて適当な溶媒と塩基を用いて反応させることによって本発明化合物を製造することができる。

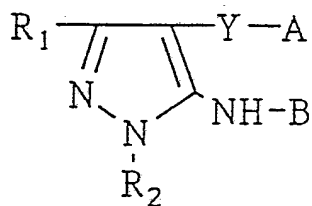
上記反応に於いて、用いられる溶媒としては、例えば、トルエン、キシレン、クロルベンゼン等の炭化水素類、ジクロロエタン、クロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、ジイソプロピルエーテル、ジオキサン等のエーテル類、酢酸エチル等のエステル類、アセトニトリル等のニトリル類、ジメチルスルホキシド、ジメチルホルムアミド等の極性溶媒が挙げられる。

また用いられる塩基としては、ピリジン、トリエチルアミン、炭酸カリウム等が挙げられる。

上記反応において反応温度は任意にとりうるが、通常 0℃～100℃が好ましい。

(製法 3)  $X = N - R^3$ 、 $R^3 \neq H$  の時

一般式 [ 9 ]



[ 9 ]

〔式中  $R^1$ ,  $R^2$ , Y, A および B は前記と同じ意味を表す。〕で示されるピラゾールと一般式 [ 1 0 ]



〔式中  $R^3$  は水素原子を除く前記と同じ意味を表し、L はハロゲン原子等の脱離基を表す。〕

で示される化合物とを必要に応じて適当な溶媒と塩基を用いて反応させることによって本発明化合物を製造することができる。

上記反応に於いて、用いられる溶媒としては、例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン等の炭化水素類、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン炭化水素類、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類、酢酸エチル等のエステル類、アセトニトリル等のニトリル類、ジメチルスルホキシド、ジメチルホルムアミド等の極性溶媒が挙げられる。

また用いられる塩基としては、ピリジン、トリエチルアミン等の有機塩基や炭酸カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が挙げられる。

上記反応において、反応温度は任意にとりうるが、通常  $0^{\circ}\text{C} \sim 100^{\circ}\text{C}$  が好ましい。

### 実施例

次に具体的な製造例を示す。

#### 製造例 1 (本発明化合物 No. 5 の合成)

4 - ( 4 - クロロフェニルチオ ) - 1, 3 - ジメチル - 5 - メルカプトピラゾール 1.4 g および 2 - クロロピリ

ミジン 1.2 g を加え、120 °C で 1.5 時間加熱撹拌した。空冷後、酢酸エチル 60 ml を加え、撹拌した後不溶分を濾別した。濾液を濃縮後、シリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開液；クロロホルム：酢酸エチル＝9：1）で精製することにより、4-（4-クロロフェニルチオ）-1,3-ジメチル-5-（2-ピリミジルチオ）ピラゾール 0.6 g を得た。

油状物  $n_D^{21.0} = 1.6465$

#### 製造例 2（本発明化合物 No. 49 の合成）

##### ① N-（1,3-ジメチル-5-ピラゾリル）ホルムアミドの合成

5-アミノ-1,3-ジメチルピラゾール 20 g をぎ酸（85%）29 g に溶解し、氷冷下、無水酢酸 55 g を滴下して加えた。室温で3日間撹拌後、減圧濃縮して、シリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開液；クロロホルム）で精製して N-（1,3-ジメチル-5-ピラゾリル）ホルムアミド 12.8 g を得た。

##### ② 1,3-ジメチル-5-（2-ピリミジルアミノ）ピラゾールの合成

水素化ナトリウム（55%）1.6 g の懸濁した N,N-ジメチルホルムアミド 70 ml の溶液に、氷冷下、N-（1,3-ジメチル-5-ピラゾリル）ホルムアミド 4.1 g（29 mmol）と N,N-ジメチルホルムアミド 10 ml の混合溶液を滴下して加えた。室温で2時間撹拌後、2-クロロピリミジン 3.4 g（30 mmol）と N,N-ジメチ



ルホルムアミド 10 ml の混合溶液を加えた。そして、100℃で加熱攪拌を2日間行った後、溶媒を減圧下留去して、水を加えてから、クロロホルムで抽出し、水洗いして、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。ろ過後、溶媒を減圧留去して残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製することにより、1,3-ジメチル-5-(2-ピリミジルアミノ)ピラゾールを2.4 g 得た。

融点 179.0 ~ 182.0 °C

### ③ 本発明化合物 Na 49 の合成

1,3-ジメチル-5-(2-ピリミジルアミノ)ピラゾール 1.1 g をクロロホルム 30 ml に溶解した。この溶液に室温下で4-クロロフェニルスルフェニルクロライド 0.5 g を滴下し、1時間攪拌反応した。有機層を水 30 ml で洗浄した後、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。

溶媒を減圧下で留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開液；クロロホルム）で精製することにより4-(4-クロロフェニルチオ)-1,3-ジメチル-5-(2-ピリミジルアミノ)ピラゾール 0.8 g を得た。融点 158.0 ~ 159.0 °C

### 製造例 3（本発明化合物 Na 172 の合成）

#### ① 1,3-ジメチル-5-(N-(2-ピリミジル)-N-メチルアミノ)ピラゾールの合成

水素化ナトリウム（55%）0.25 g の懸濁した THF 10 ml の溶液に、氷冷下、1,3-ジメチル-5-(2-ピリミジルアミノ)ピラゾール 1.0 g を少しずつ加えた

後、60℃で1時間攪拌した。この溶液を室温に冷却し、ヨウ化メチル4.1 gを加え、ゆるやかに2時間還流した。空冷後、水10 mlを加え、ジエチルエーテル30 mlで3回抽出した。エーテル層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を減圧留去して残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開液；クロロホルム）で精製することにより1,3-ジメチル-5-(N-(2-ピリミジル)-N-メチルアミノ)ピラゾール 0.5 gを得た。（黄色油状物）

## ② 本発明化合物 Na 172 の合成

1,3-ジメチル-5-(N-(2-ピリミジル)-N-メチルアミノ)ピラゾール 0.2 gを溶解したクロロホルム溶液 10ml に、p-クロロフェニルスルフェニルクロライド 0.14 gを滴下し、室温下で15時間攪拌した。

溶媒を減圧留去して残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開液；クロロホルム）で精製することにより4-(4-クロロフェニルチオ)-1,3-ジメチル-5-(N-(2-ピリミジル)-N-メチルアミノ)ピラゾール 0.25 gを得た。融点 77.0 ~ 78.0 °C

## 製造例 4（本発明化合物 Na 314 の合成）

### ① 1,3-ジメチル-5-(2-ピリジルアミノ)ピラゾールの合成

N-(1,3-ジメチル-5-ピラゾリル)ホルムアミド 10 gと2-ブロモピリジン 10.2gのN,N-ジメチルホルムアミド60 mlの混合溶液に、無水炭酸カリウム 9.9 g

と銅 (II) アセチルアセトナート 1 g を加え、3 時間加熱還流した。溶媒を減圧留去した後、水を加えクロロホルムで抽出した。有機層を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。

溶媒を減圧留去して残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (展開液; クロロホルム-酢酸エチル) で精製することにより 1,3-ジメチル-5-(2-ピリジルアミノ)ピラゾール 4.6 g を得た。

融点 113.0 ~ 115.0 °C

## ② 本発明化合物 No. 314 の合成

1,3-ジメチル-5-(2-ピリジルアミノ)ピラゾール 1.27g をクロロホルム 50ml に溶解し、氷水で冷却した。この溶液に 2,4-ジクロロフェニルスルフェニルクロライド 1.55g を滴下し、室温下で 15 時間攪拌した。

この溶液を炭酸水素ナトリウム水溶液、次に水で洗浄した後、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を減圧留去して残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (展開液; クロロホルム) で精製することにより、4-(2,4-ジクロロフェニルチオ)-1,3-ジメチル-5-(2-ピリジルアミノ)ピラゾール 1.75g を得た。

融点 144.0 ~ 145.0 °C

## 製造例 5 (本発明化合物 No. 435 の合成)

### ① 2-ピリジル-(1,3-ジメチル-5-ピラゾリル)メタノールの合成

2-ブロモピリジン 5.5 g を溶解した乾燥テトラヒ

ドロフラン溶液 300 ml を  $-78^{\circ}\text{C}$  に冷却し、これに *n*-ブチルリチウムヘキサン溶液 (15 W/W%) 5.45 g をゆっくりと滴下し、30 分間攪拌した。次に、1,3-ジメチル-5-ホルミルピラゾール 4.2 g を  $-78^{\circ}\text{C}$  でゆっくりと滴下した。この後ゆっくりと室温にまで昇温し 15 時間攪拌した。

この溶液に 2 規定の塩酸を加えて中性にした後、酢酸エチル 150 ml で 3 回抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を減圧留去して残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (展開液; クロロホルム) で精製することにより、2-ピリジル-(1,3-ジメチル-5-ピラゾリル) メタノール 5.2 g を褐色油状物として得た。

## ② 本発明化合物 Na 435 の合成

2-ピリジル-(1,3-ジメチル-5-ピラゾリル) メタノール 3 g を溶解した乾燥クロロホルム溶液 60 ml に室温下で *p*-クロロフェニルスルフェニルクロライド 3.4 g を滴下し、12 時間攪拌した。溶媒を留去した後、酢酸エチル 50 ml、10% 炭酸水素ナトリウム水溶液 50 ml を加えて 30 分間攪拌した。有機層を分離した後、さらに水層を酢酸エチル 50 ml で 3 回抽出した。合わせた有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を減圧留去した後残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (展開液; クロロホルム) で精製することにより、2-ピリジル-(4-(4-クロロフェニルチオ))-1,3-ジ

メチル-5-ピラゾリル)メタノール 1.2 g を白色結晶として得た。融点 90.0 ~ 91.0 °C

製造例 6 (本発明化合物 No. 451 の合成)

製造例 5 で得られた本発明化合物 No. 435 1.2 g を乾燥ジクロロメタン 50 ml に溶解した溶液に、室温で二酸化マンガン 1.5 g を加え 2 時間攪拌した。無機物をセライトで濾別した後溶媒を減圧留去し、残渣をジイソプロピルエーテルで結晶化させることにより 2-ピリジル-(4-(4-クロロフェニルチオ))-1,3-ジメチル-5-ピラゾリル)ケトン 1.0 g を白色結晶として得た。融点 111.0 ~ 113.0 °C

これらの方法に準じて製造した化合物の物性を第 3 表に示す。

第 3 表

化合物			<sup>1</sup> H-NMR	
No	物 性	$\delta$ (ppm, CDCl <sub>3</sub> )	標準物質 TMS	
5	油状物	$n_D^{21.0} = 1.6465$		
4 7	m.p.	150.0 ~ 151.0 °C		
4 9	m.p.	158.0 ~ 159.0 °C		
5 2	m.p.	170.0 ~ 171.0 °C		
5 5	m.p.	150.0 ~ 152.0 °C		
5 6	m.p.	181.0 ~ 182.0 °C		
5 7	m.p.	190.0 ~ 193.0 °C		
5 8	m.p.	159.0 ~ 162.0 °C		

第 3 表 ( 続き )

化合物		<sup>1</sup> H-NMR	
№	物 性	δ (ppm, CDCl <sub>3</sub> )	標準物質 TMS
5 9	m.p.	168.5 ~ 171.5 °C	
6 0	m.p.	157.0 ~ 158.0 °C	
6 1	m.p.	170.5 ~ 172.5 °C	
6 3	m.p.	160.0 ~ 162.0 °C	
6 4	m.p.	156.0 ~ 157.0 °C	
6 6	m.p.	180.0 ~ 183.0 °C	
6 7	m.p.	125.5 ~ 127.0 °C	
6 8	m.p.	154.0 ~ 157.0 °C	
6 9	m.p.	126.0 ~ 127.0 °C	

第 3 表 (続き)

化合物		<sup>1</sup> H-NMR	
No.	物 性	$\delta$ (ppm, CDCl <sub>3</sub> )、標準物質 TMS	
7 0	m.p.	178.0 ~ 179.0	°C
7 1	m.p.	163.5 ~ 167.5	°C
7 2	m.p.	174.0 ~ 176.0	°C
7 3	m.p.	132.5 ~ 135.5	°C
7 6	m.p.	148.0 ~ 151.0	°C
7 9	m.p.	127.5 ~ 128.5	°C
8 1	m.p.	180.0 ~ 184.0	°C
8 3	m.p.	175.0 ~ 177.0	°C



第 3 表 ( 続き )

化合物		<sup>1</sup> H-NMR	
Na	物 性	δ (ppm, CDCl <sub>3</sub> )	標準物質 TMS
9 5	m.p.	160.0 ~ 162.0 °C	
9 6	m.p.	180.0 ~ 181.5 °C	
9 7	m.p.	186.0 ~ 188.5 °C	
9 8	m.p.	201.0 ~ 205.0 °C	
9 9	m.p.	166.0 ~ 168.0 °C	
1 0 0	m.p.	164.5 ~ 166.5 °C	
1 0 2	m.p.	161.0 ~ 163.0 °C	
1 0 5	m.p.	148.5 ~ 150.0 °C	
1 0 6	m.p.	134.5 ~ 137.0 °C	

第 3 表 ( 続き )

化合物		<sup>1</sup> H-NMR	
No.	物 性	$\delta$ (ppm, CDCl <sub>3</sub> )	標準物質 TMS
1 0 8	m.p.	189.0 ~ 191.0 °C	
1 1 0	m.p.	135.0 ~ 137.0 °C	
1 1 3	m.p.	178.0 ~ 180.0 °C	
1 1 6	m.p.	158.0 ~ 160.0 °C	
1 2 0	m.p.	164.0 ~ 166.0 °C	
1 2 4	m.p.	140.0 ~ 141.0 °C	
1 2 6	m.p.	159.0 ~ 161.0 °C	
1 2 9	m.p.	147.0 ~ 148.0 °C	
1 3 2	m.p.	181.0 ~ 183.0 °C	

第 3 表 ( 続き )

化合物 No.	物 性	<sup>1</sup> H-NMR	
		$\delta$ (ppm, CDCl <sub>3</sub> )	標準物質 T M S
1 3 3	m. p.	196.0 ~ 198.0	°C
1 4 2	m. p.	162.0 ~ 164.0	°C
1 4 4	m. p.	143.0 ~ 145.0	°C
1 4 6	m. p.	151.5 ~ 153.5	°C
1 4 9	m. p.	214.0 ~ 216.0	°C
1 5 4	m. p.	139.0 ~ 140.0	°C
1 5 7	m. p.	192.5 ~ 195.5	°C
1 5 9	m. p.	190.5 ~ 193.5	°C
1 6 7	m. p.	123.0 ~ 124.0	°C

第 3 表 (続き)

化合物		<sup>1</sup> H-NMR	
No.	物 性	$\delta$ (ppm, CDCl <sub>3</sub> )、標準物質 TMS	
1 6 8	m.p. 152.0 ~ 154.0 °C		
1 6 9	半結晶状	2.20(s, 3H), 3.65(s, 3H), 3.69(s, 3H), 6.60 ~ 7.00(m, 5H), 8.35(d, 2H, J=5Hz)	
1 7 0	m.p. 183.0 ~ 184.0 °C		
1 7 2	m.p. 77.0 ~ 78.0 °C		
1 7 5	m.p. 70.0 ~ 72.0 °C		
1 7 6	油状物	$n_D^{21.0} = 1.5957$	
1 7 7	m.p. 84.0 ~ 87.0 °C		
1 7 8	m.p. 83.0 ~ 85.0 °C		

第 3 表 ( 続き )

化合物	物 性	<sup>1</sup> H-NMR	$\delta$ (ppm, CDCl <sub>3</sub> )、標準物質 T M S
1 7 9	油 状 物	1 8 0 m. p. 98.0 ~ 100.0 °C	2.08(s, 3H), 2.19(s, 3H), 3.79(s, 3H), 4.09(d, 1H, J=18Hz), 5.10(d, 1H, J=18Hz) 6.54(t, 1H, J=5Hz), 6.90(s, 4H), 8.13(d, 2H, J=5Hz)
1 8 2	m. p. 128.0 ~ 129.0 °C	1 8 4 油 状 物	2.20(s, 3H), 3.21(s, 3H), 4.50(d, 1H, J=14Hz), 5.52(d, 1H, J=14Hz), 6.58(t, 1H, J=5Hz), 6.91(s, 4H), 7.08(s, 4H), 8.18(d, 2H, J=5Hz)
1 8 7	m. p. 164.0 ~ 166.0 °C		

第 3 表 ( 続き )

化合物		<sup>1</sup> H-NMR	
No	物 性	$\delta$ (ppm, CDCl <sub>3</sub> )、標準物質 TMS	
1 8 8	m. p.	189.0 ~ 191.0	°C
1 9 4	m. p.	142.0 ~ 143.5	°C
1 9 5	m. p.	140.5 ~ 141.5	°C
1 9 7	m. p.	149.0 ~ 152.0	°C
1 9 8	m. p.	168.5 ~ 169.5	°C
1 9 9	m. p.	164.5 ~ 167.0	°C
2 0 1	m. p.	183.0 ~ 187.0	°C
2 1 6	m. p.	205.0 ~ 207.0	°C
2 9 1	m. p.	194.0 ~ 196.0	°C

第 3 表 ( 続き )

化合物 No.	物 性	<sup>1</sup> H-NMR	
		$\delta$ (ppm, CDCl <sub>3</sub> )	標準物質 TMS
2 9 2	m.p.	186.0 ~ 188.0	°C
3 0 1	m.p.	148.0 ~ 150.0	°C
3 0 3	m.p.	165.0 ~ 166.0	°C
3 1 1	m.p.	127.0 ~ 128.0	°C
3 1 2	m.p.	167.0 ~ 168.0	°C
3 1 4	m.p.	144.0 ~ 145.0	°C
3 1 5	m.p.	126.0 ~ 128.0	°C
3 1 6	m.p.	145.0 ~ 147.0	°C
3 1 7	m.p.	118.0 ~ 120.0	°C

第 3 表 ( 続き )

化合物		<sup>1</sup> H-NMR	
No.	物 性	δ (ppm, CDCl <sub>3</sub> )	標準物質 TMS
3 1 8	m. p.	112.0 ~ 114.0	°C
3 1 9	m. p.	99.0 ~ 100.0	°C
3 2 0	m. p.	99.0 ~ 100.0	°C
3 2 1	m. p.	122.0 ~ 124.0	°C
3 2 2	m. p.	107.0 ~ 108.0	°C
3 2 6	m. p.	158.0 ~ 160.0	°C
3 2 8	m. p.	168.0 ~ 169.0	°C
3 3 9	m. p.	147.0 ~ 148.0	°C
3 4 1	m. p.	128.0 ~ 130.0	°C



第 3 表 ( 続 き )

化合物		<sup>1</sup> H-NMR	
Na	物 性	$\delta$ (ppm, CDCl <sub>3</sub> )	標準物質 TMS
3 4 3	m.p.	128.0 ~ 131.0 °C	
3 4 4	m.p.	180.0 ~ 181.0 °C	
3 4 5	m.p.	301.0 ~ 302.0 °C	
3 4 6	m.p.	185.0 ~ 186.0 °C	
3 4 7	m.p.	106.0 ~ 107.0 °C	
3 5 1	m.p.	160.0 ~ 161.0 °C	
3 5 2	m.p.	161.0 ~ 163.0 °C	
3 5 4	m.p.	142.0 ~ 144.0 °C	
3 5 5	m.p.	128.0 ~ 130.0 °C	

第 3 表 ( 続 き )

化合物		<sup>1</sup> H-NMR	
Na	物 性	δ (ppm, CDCl <sub>3</sub> )	標準物質 T M S
3 6 3	m.p. 148.0 ~ 149.0 °C		
3 6 5	m.p. 172.0 ~ 174.0 °C		
3 6 7	m.p. 132.0 ~ 133.0 °C		
3 9 1	m.p. 140.0 ~ 141.0 °C		
4 0 2	樹脂状	2.15(s, 3H), 3.70(s, 3H), 4.62(bs, 2H), 6.50 ~ 7.20(m, 4H), 8.16(d, 2H, J=5Hz)	
4 3 5	m.p. 90.0 ~ 91.0 °C		
4 3 6	m.p. 142.0 ~ 145.0 °C		

第 3 表 ( 続 き )

化合物		<sup>1</sup> H-NMR	
No.	物 性	δ (ppm, CDCl <sub>3</sub> )	標準物質 T M S
4 4 0	樹脂 状	2. 20(s, 6H), 3. 55(s, 3H), 5. 10(bs, 1H), 6. 05(s, 1H), 6. 50~7. 60(m, 6H), 8. 40(d, 1H, J=5Hz)	
4 4 1	油 状 物	2. 17(s, 3H), 3. 30(s, 3H), 3. 68(s, 3H), 5. 68(s, 1H), 6. 80~7. 70(m, 7H), 8. 30~8. 50(m, 1H)	
4 4 3	油 状 物	2. 10(s, 3H), 2. 25(s, 3H), 4. 05(s, 3H), 6. 80~8. 70(m, 9H),	

第 3 表 ( 続 き )

化合物	<sup>1</sup> H-NMR
No	物 性 δ (ppm, CDCl <sub>3</sub> )、標準物質 TMS
4 4 7	油 状 物 2.19(s, 3H), 3.77(s, 3H), 6.67(d, 1H, J=45Hz), 6.90~7.70(m, 7H), 8.51(d, 1H, J=5Hz)
4 5 1	m.p. 111.0~113.0 °C
4 5 5	油 状 物 2.03(s, 3H), 2.16(s, 3H), 3.69(s, 3H), 6.00(bs, 1H), 6.80~8.51(m, 8H)
4 6 3	樹 脂 状 0.50(d, 3H, J=7Hz), 1.00(d, 3H, J=7Hz), 2.02(s, 3H), 3.21~3.65(m, 1H), 3.87(s, 3H), 6.00(bs, 3H), 6.61~8.35(m, 8H)

第 3 表 ( 続き )

化合物	物 性	<sup>1</sup> H-NMR
No.	性	$\delta$ (ppm, CDCl <sub>3</sub> )、標準物質 TMS
4 8 1	半結晶状	2.26(s, 3H), 3.72(s, 3H), 6.62(t, 1H, J=5Hz), 6.88(t, 1H, J=5Hz), 7.61(bs, 1H), 8.23(d, 2H, J=5Hz), 8.34(d, 2H, J=5Hz)
4 8 3	m. p. 167.0~169.0 °C	
4 8 5	m. p. 187.0~189.0 °C	
4 9 7	m. p. 204.0~206.0 °C	
4 9 9	m. p. 159.0~161.0 °C	

本発明化合物を農園芸用殺菌剤として使用するにあたっては、一般には適当な担体、例えばクレー、タルク、ベントナント、珪藻土等の固体担体あるいは水、アルコール類（メタノール、エタノール等）、芳香族炭化水素類（ベンゼン、トルエン、キシレン等）、塩素化炭化水素類、エーテル類、ケトン類、エステル類（酢酸エチル等）、酸アミド類（ジメチルホルムアミド等）などの液体担体と混用して適用することができ、所望により乳化剤、分散剤、懸濁剤、浸透剤、展着剤、安定剤などを添加し、液剤、油剤、乳剤、水和剤、粉剤、粒剤、フロアブル剤等任意の剤型にて実用に供することができる。

また、必要に応じて製剤または散布時に他種の除草剤、各種殺虫剤、殺菌剤、植物生長調節剤、共力剤などと混合施用してもよい。

本発明化合物の施用薬量は適用場面、施用時期、施用方法、対象病害、栽培作物等により差異はあるが一般には有効成分量としてヘクタール当たり0.005～50kg程度が適当である。

次に、本発明化合物を有効成分とする殺菌剤の製剤例を示すがこれらのみに限定されるものではない。なお、以下の製剤例において「部」は重量部を意味する。

製剤例 1      乳      剤

本発明化合物	----- 20 部
キシレン	----- 55 部
N, N-ジメチルホルムアミド	----- 20 部

ソルポール 2 6 8 0 ----- 5 部

(非イオン性界面活性剤とアニオン性界面活性剤との混合物：東邦化学工業(株)商品名)

以上を均一に混合して乳剤とする。使用に際しては上記乳剤を50～20000倍に希釈して有効成分量がヘクタール当たり 0.005～50kgになるように散布する。

#### 製剤例 2 水和剤

本発明化合物 ----- 25 部

ジークライト P F P ----- 66 部

(カオリナイトとセリサイトの混合物；ジークライト工業(株)商品名)

ソルポール 5 0 8 9 ----- 4 部

(アニオン性界面活性剤：東邦化学工業(株)商品名)

カープレックス # 8 0 ----- 3 部

(ホワイトカーボン：塩野義製薬(株)商品名)

リグニンスルホン酸カルシウム ----- 2 部

以上を均一に混合粉碎して水和剤とする。

使用に際しては上記水和剤を50～20000倍に希釈して有効成分量がヘクタール当たり 0.005～50kgになるように散布する。

#### 製剤例 3 油 剤

本発明化合物 ----- 10 部

メチルセルソルブ ----- 90 部

以上を均一に混合して油剤とする。使用に際して上記油剤を有効成分量がヘクタール当たり 0.005～50kgにな

るように散布する。

#### 製剤例 4 粉 剤

本発明化合物	-----	3.0部
カーブレックス#80	-----	0.5部
(ホワイトカーボン：塩野義製薬(株)商品名)		
クレー	-----	95部
リン酸ジイソプロピル	-----	1.5部

以上を均一に混合粉碎して粉剤とする。使用に際して上記粉剤を有効成分量がヘクター当たり 0.005～50kg になるように散布する。

#### 製剤例 5 粒 剤

本発明化合物	-----	5部
ベントナイト	-----	54部
タルク	-----	40部
リグニンスルホン酸カルシウム	-----	1部

以上を均一に混合粉碎して少量の水を加えて攪拌混合し、押出式造粒機で造粒し、乾燥して粒剤とする。使用に際して上記粒剤を有効成分量がヘクター当たり 0.005～50kg になるように散布する。

#### 製剤例 6 フロアブル剤

本発明化合物	-----	25部
ソルポール 3353	-----	10部
(非イオン性界面活性剤：東邦化学工業(株)商品名)		
ルノックス 1000C	-----	0.5部
(陰イオン界面活性剤：東邦化学工業(株)商品名)		



1 % ザンサンガム水溶液 ----- 20 部

(天然高分子)

水 ----- 44.5部

有効成分(本発明化合物)を除く上記の成分を均一に溶解し、ついで本発明化合物を加えよく攪拌した後、サンドミルにて湿式粉碎してフロアブル剤を得る。使用に際しては、上記フロアブル剤を50～20000倍に希釈して有効成分量がヘクター当たり0.005～50kgになるように散布する。

次に、本発明化合物によって防除できる植物病害としては、イネのいもち病(*Pyricularia oryzae*)、ごま葉枯病(*Cochliobolus miyabeanus*)、紋枯病(*Rhizoctonia solani*)、ムギ類のうどんこ病(*Erysiphe graminis* f.sp.*hordei*, f. sp.*tritici*)、斑葉病(*Pyrenophora graminea*)、網斑病(*Pyrenophora teres*)、赤かび病(*Gibberella zeae*)、さび病(*Puccinia striiformis*, *P. graminis*, *P. recondita*, *P. hordei*)、雪腐病(*Typhula* sp., *Micronectriella nivais*)、裸黒穂病(*Ustilago tritici*, *U. nuda*)、アイスポット(*Pseudocercospora herpotrichoides*)、雲形病(*Rhynchosporium secalis*)、葉枯病(*Septoria tritici*)、ふ枯病(*Leptosphaeria nodorum*)、カンキツの黒点病(*Diaporthe citri*)、そうか病(*Elsinoe fawcetti*)、果実腐敗病(*Penicillium digitatum*, *P. italicum*)、リンゴのモニリア病

(*Sclerotinia mali*)、腐らん病 (*Valsa mali*)、  
うどんこ病 (*Podosphaera leucotricha*)、斑点落葉病  
(*Alternaria mali*)、黒星病 (*Venturia inaequalis*)、  
ナシの黒星病 (*Venturia nashicola*)、黒斑病  
(*Alternaria Kikuchiana*)、赤星病 (*Gymnosporangium  
haraeanum*)、モモの灰星病 (*Sclerotinia cinerea*)、  
黒星病 (*Cladosporium carpophilum*)、フオモプシス腐敗  
病 (*Phomopsis* sp.)、ブドウのべと病 (*Plasmopara  
viticola*)、黒とう病 (*Elsinoe ampelina*)、  
晩腐病 (*Glomerella cingulata*)、うどんこ病 (*Uncinula  
necator*)、さび病 (*Phakopsora ampelopsidis*)、  
カキの炭そ病 (*Gloeosporium kaki*)、落葉病  
(*Cercospora kaki*, *Mycosphaerella nawae*)、ウリ類の  
べと病 (*Pseudoperenospora cubensis*)、炭そ病  
(*Colletotrichum lagenarium*)、うどんこ病  
(*Sphaerotheca fuliginea*)、つる枯病 (*Mycosphaerella  
melonis*)、トマトの疫病 (*Phytophthora infestans*)、  
輪紋病 (*Alternaria solani*)、葉かび病 (*Cladosporium  
fulvam*)、ナスの褐紋病 (*Phomopsis vexans*)、うどん  
こ病 (*Erysiphe cichoracoarum*)、アブラナ科野菜の黒  
斑病 (*Alternaria japonica*)、白斑病 (*Cercospora  
brassicae*)、ネギのさび病 (*Puccinia allii*)、ダイズの  
紫斑病 (*Cercospora kikuchii*)、黒とう病 (*Elsinoe  
glycines*)、黒点病 (*Diaporthe phaseololum*)、インゲ  
ンの炭そ病 (*Colletotrichum lindemuthianum*)、ラッカ

セイの黒渋病 (*Mycosphaerella personatum*)、褐斑病 (*Cercospora arachidicola*)、エンドウのうどんこ病 (*Erysiphe pisi*)、ジャガイモの夏疫病 (*Alternaria solani*)、イチゴのうどんこ病 (*Sphaerotheca humuli*)、チャの網もち病 (*Exobasidium reticulatum*)、白星病 (*Elsinoe leucospila*)、タバコの赤星病 (*Alternaria longipes*)、うどんこ病 (*Erysiphe cichoracearum*)、炭そ病 (*Colletotrichum tabacum*)、テンサイの褐斑病 (*Cercospora beticola*)、バラの黒星病 (*Diplocarpon rosae*)、うどんこ病 (*Sphaerotheca pannosa*)、キクの褐斑病 (*Septoria chrysanthemiindici*)、白さび病 (*Puccinia horiana*)、種々の作物の灰色かび病 (*Botrytis cinerea*)、菌核病 (*Sclerotinia sclerotiorum*) 等が挙げられる。

本発明化合物の有用性について、以下の試験例において具体的に説明する。但し、これらのみに限定されるものではない。

#### 試験例 1 灰色かび病防除効果試験

直径 7 cm のポットで育成した 2 ～ 3 葉期のトマト (品種：福寿) に、本発明化合物乳剤を水で希釈して 500 ppm に調製した薬液をスプレーガンを用いポット当たり 20 ml 散布した。

散布翌日トマト灰色かび病菌 (*Botrytis cinerea*) の孢子懸濁液 (1.0 % グルコース、2.5 % 酵母エキス含有、 $\times 150 \cdot 40$  個 / 視野) を噴霧し、温度 25 °C、湿度

95%以上の接種箱に5日間置き、その後に形成された病斑が接種葉に占める割合を測定し、下記の式に従い、防除価を算出した。

防除価＝

$$\left[ 1 - \left( \text{処理区病斑面積率} / \text{無処理区病斑面積率} \right) \right] \times 100$$

その結果、以下の化合物が防除価100を示した。

本発明化合物 Na 5 , Na 4 9 、 Na 5 2 、 Na 5 6 、 Na 5 8 、  
Na 5 9 、 Na 6 3 、 Na 6 7 、 Na 6 8 、 Na 9 5 、 Na 9 6 、  
Na 9 9 、 Na 105 、 Na 108 、 Na 110 、 Na 116 、 Na 120 、  
Na 124 、 Na 126 、 Na 129 、 Na 132 、 Na 133 、 Na 142 、  
Na 154 、 Na 157 、 Na 167 、 Na 172 、 Na 301 、 Na 311 、  
Na 312 、 Na 314 、 Na 315 、 Na 316 、 Na 317 、 Na 318 、  
Na 319 、 Na 320 、 Na 321 、 Na 322 、 Na 326 、 Na 328 、  
Na 343 、 Na 383 、 Na 391 、 Na 402 、 Na 447

#### 試験例 2 イネ紋枯病防除効果試験

直径5cmのポットで育成した3～4葉期のイネ（品種：日本晴）に、本発明化合物乳剤を水で希釈して500ppmに調製した薬液を5ml株元灌注した直後、同一ポットにポット当たり15ml散布した。

処理3日後に紋枯病（*Rhizoctonia solani*）汚染籾穀を株元に置き接種した。

その後ポットを、温度28℃、湿度95%以上の接種

箱に置き、接種 5 日後に形成された病斑の地極よりの高さを測定し下記の式に従い防除価を算出した。

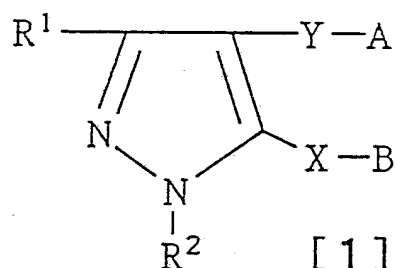
$$\text{防除価} = \left[ 1 - \left( \text{処理区病斑高} / \text{無処理区病斑高} \right) \right] \times 100$$

その結果以下の化合物が防除価 100 を示した。

本発明化合物 Na 5、Na 47、Na 49、Na 52、Na 55、  
Na 56、Na 57、Na 59、Na 68、Na 69、Na 70、  
Na 71、Na 72、Na 79、Na 81、Na 96、Na 97、  
Na 99、Na 100、Na 102、Na 105、Na 108、Na 110、  
Na 113、Na 124、Na 126、Na 129、Na 142、Na 144、  
Na 146、Na 154、Na 157、Na 167、Na 168、Na 169、  
Na 172、Na 175、Na 178、Na 179、Na 182、Na 188、  
Na 194、Na 291、Na 292、Na 301、Na 312、Na 314、  
Na 316、Na 317、Na 318、Na 319、Na 320、Na 321、  
Na 322、Na 326、Na 328、Na 363、Na 365、Na 367、  
Na 383、Na 391、Na 402、Na 435、Na 436、Na 440、  
Na 441、Na 447、Na 451、Na 481、Na 483、Na 485、  
Na 499。

## 請求の範囲

## 1. 一般式 [1] :



〔上記式中、 $R^1$ は、水素原子、ハロゲン原子、アルキル基、アルコキシ基、アルキルチオ基またはハロアルキル基を表し、

$R^2$ は、水素原子、アルキル基、ハロアルキル基、無置換もしくは置換基を有するフェニルアルキル基、 $-COR^6$ または $-SO_2R^7$ を表し、

$X$ は、 $-S-$ 、 $-SO-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-N(R^3)-$ 、 $-CO-$ または $-C(R^4)(R^5)-$ を表し、

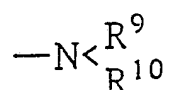
$R^3$ は、水素原子、アルキル基、ハロアルキル基、アルケニル基、アルキニル基、アルコキシアルキル基、シアノアルキル基、アルキルカルボニルアルキル基、アルコキシカルボニルアルキル基、ニトロソ基、アミノ基、無置換もしくは置換基を有するフェニルアルキル基、 $-COR^6$ または $-SO_2R^7$ を表し、

$R^4$ および $R^5$ は、それぞれ独立に水素原子、ハロゲン原子、アルキル基、ハロアルキル基、アルケニル基、アルキニル基または $-OR^8$ を表し、

$R^8$ は、水素原子、アルキル基、ハロアルキル基、アル

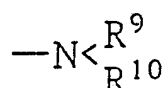
ケニル基、アルキニル基、アルコキシアルキル基、シア  
ノアルキル基、アルキルカルボニルアルキル基、アルコ  
キシカルボニルアルキル基、無置換もしくは置換基を有  
するフェニルアルキル基、 $-\text{COR}^6$  または  $-\text{SO}_2\text{R}^7$  を表し、

$\text{R}^6$  は、水素原子、アルキル基、ハロアルキル基、無置  
換もしくは置換基を有するフェニル基、無置換もしくは  
置換基を有するフェニルアルキル基、アルコキシ基また  
は



を表し、

$\text{R}^7$  は、アルキル基、ハロアルキル基、無置換もしくは  
置換基を有するフェニル基または



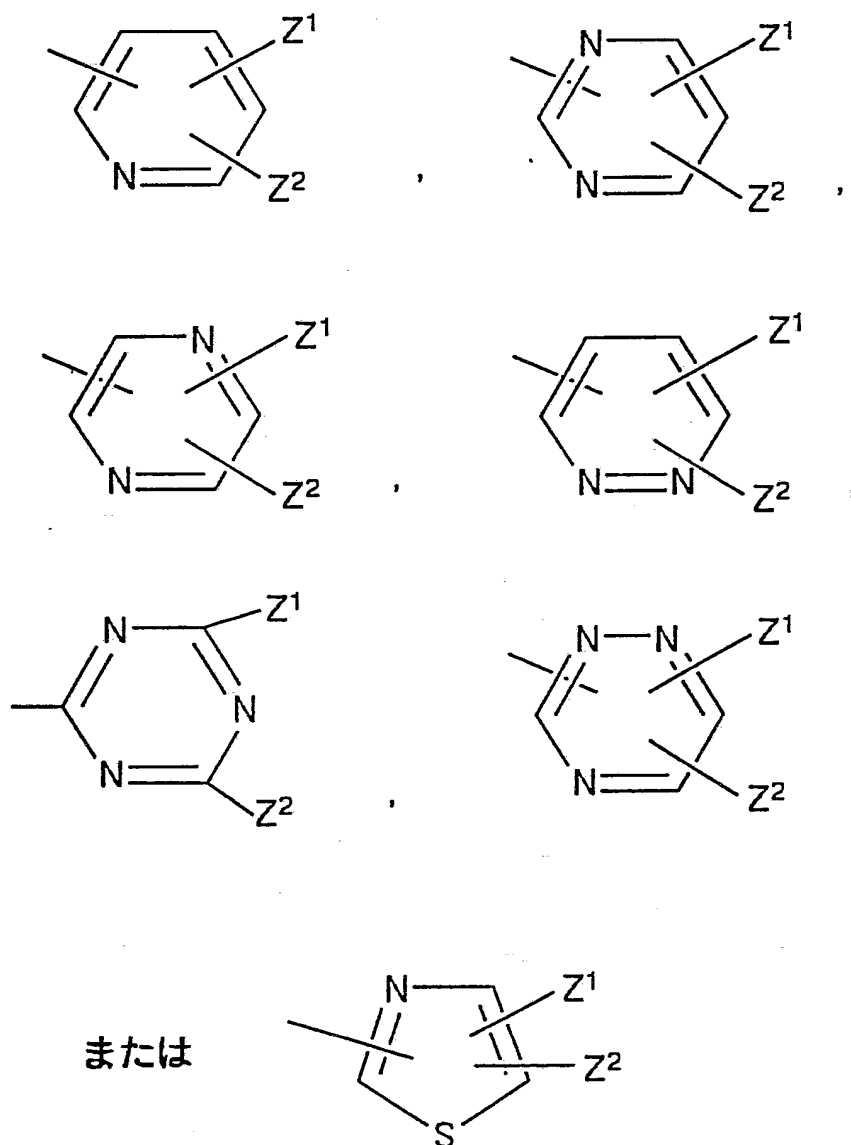
を表し、

$\text{R}^8$  および  $\text{R}^{10}$  は、それぞれ独立に水素原子、アルキル  
基または無置換もしくは置換基を有するフェニル基を表  
し、

$\text{Y}$  は、酸素原子、 $-\text{S}-$ 、 $-\text{SO}-$ 、または  $-\text{SO}_2-$  を表し、

$\text{A}$  は、無置換もしくは置換基を有するフェニル基また  
は無置換もしくは置換基を有する複素環基を表し、

$\text{B}$  は、



を表し、

$Z^1$ および $Z^2$ は、それぞれ独立に水素原子、ハロゲン原子、アルキル基、アルコキシ基、ハロアルキル基を表す。  
 。) で表される置換ピラゾール誘導体。

2. Aが、置換基を有するフェニル基である請求項1記載の置換ピラゾール誘導体。

3. Xが、 $-N(R^8)-$ である請求項1記載の置換ピ



ラゾール誘導体。

4. Yが、-S-である請求項2記載の置換ピラゾール誘導体。

5.  $R^1$ および $R^2$ が、低級アルキル基で、Xが、 $-N(R^3)-$ で、Yが、-S-で、Aが、置換基を有するフェニル基で、且つBが、無置換のピリジル基もしくは無置換のピリミジル基である請求項1記載の置換ピラゾール誘導体。

6. 請求項1記載の置換ピラゾール誘導体の1種または2種以上を有効成分として含有する農園芸用殺菌剤。

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No PCT/JP91/01538

<b>I. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER</b> (if several classification symbols apply, indicate all) <sup>6</sup>		
According to International Patent Classification (IPC) or to both National Classification and IPC <span style="float: right;">Int. Cl<sup>5</sup></span> C07D401/06, 401/12, 401/14, 403/06, 403/12, 403/14, 417/06, 417/12, 417/14, A01N43/54, 43/56, 43/58, 43/60, 43/707, 43/78		
<b>II. FIELDS SEARCHED</b>		
Minimum Documentation Searched <sup>7</sup>		
Classification System	Classification Symbols	
IPC	C07D401/06-401/14, 403/06-403/14, 417/06-417/14, A01N43/54-43/62, 43/707, 43/78	
Documentation Searched other than Minimum Documentation to the Extent that such Documents are Included in the Fields Searched <sup>8</sup>		
<b>III. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT</b> <sup>9</sup>		
Category *	Citation of Document, <sup>11</sup> with indication, where appropriate, of the relevant passages <sup>12</sup>	Relevant to Claim No. <sup>13</sup>
A	JP, A, 01-125379 (Sumitomo Chemical Co., Ltd.), May 17, 1989 (17. 05. 89), (Family: none)	1-5, 6
<div style="display: flex; justify-content: space-between;"> <div style="width: 45%;"> <p>* Special categories of cited documents: <sup>10</sup></p> <p>"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance</p> <p>"E" earlier document but published on or after the international filing date</p> <p>"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)</p> <p>"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means</p> <p>"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed</p> </div> <div style="width: 45%;"> <p>"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention</p> <p>"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step</p> <p>"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art</p> <p>"&amp;" document member of the same patent family</p> </div> </div>		
<b>IV. CERTIFICATION</b>		
Date of the Actual Completion of the International Search		Date of Mailing of this International Search Report
January 8, 1992 (08. 01. 92)		January 28, 1992 (28. 01. 92)
International Searching Authority		Signature of Authorized Officer
Japanese Patent Office		

国 際 調 査 報 告

国際出願番号PCT/JP 91 / 0 1 5 3 8

I. 発明の属する分野の分類			
国際特許分類 (IPC) <b>Int. Cl.<sup>8</sup> C 07 D 4 0 1 / 0 6, 4 0 1 / 1 2, 4 0 1 / 1 4, 4 0 3 / 0 6, 4 0 3 / 1 2, 4 0 3 / 1 4, 4 1 7 / 0 6, 4 1 7 / 1 2, 4 1 7 / 1 4, A 0 1 N 4 3 / 5 4, 4 3 / 5 6, 4 3 / 5 8, 4 3 / 6 0, 4 3 / 7 0 7, 4 3 / 7 8</b>			
II. 国際調査を行った分野			
調 査 を 行 っ た 最 小 限 資 料			
分 類 体 系	分 類 記 号		
IPC	<b>C 0 7 D 4 0 1 / 0 6 - 4 0 1 / 1 4, 4 0 3 / 0 6 - 4 0 3 / 1 4, 4 1 7 / 0 6 - 4 1 7 / 1 4, A 0 1 N 4 3 / 5 4 - 4 3 / 6 2, 4 3 / 7 0 7, 4 3 / 7 8</b>		
最小限資料以外の資料で調査を行ったもの			
III. 関連する技術に関する文献			
引用文献の カテゴリー ※	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示		請求の範囲の番号
A	<b>JP, A, 0 1 - 1 2 5 3 7 9 (住友化学工業株式会社), 1 7. 5 月. 1 9 8 9 (1 7. 0 5. 8 9), (ファミリーなし)</b>		1 - 5, 6
※引用文献のカテゴリー 「A」 特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの 「E」 先行文献ではあるが、国際出願日以後に公表されたもの 「L」 優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す) 「O」 口頭による開示、使用、展示等に言及する文献 「P」 国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願の日の後に公表された文献 「T」 国際出願日又は優先日の後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの 「X」 特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの 「Y」 特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの 「&」 同一パテントファミリーの文献			
IV. 認 証			
国際調査を完了した日		国際調査報告の発送日	
0 8. 0 1. 9 2		28.01.92	
国際調査機関		権限のある職員	4 C 8 8 2 9
日本国特許庁 (ISA/JP)		特許庁審査官	小 柳 正 之 ㊞